

04 OCT 2004



MINISTERIO
DE INDUSTRIA, TURISMO
Y COMERCIO

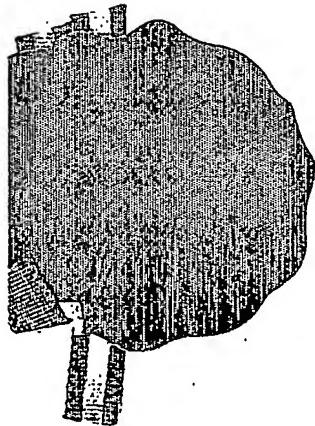


REC'D 18 OCT 2004
WIPO PCT

CERTIFICADO OFICIAL

Por la presente certifico que los documentos adjuntos son copia exacta de la solicitud de PATENTE de INVENCION número 200301812, que tiene fecha de presentación en este Organismo el 30 de Julio de 2003.

Madrid, 28 de Julio de 2004



El Director del Departamento de Patentes
e Información Tecnológica.

P.D.

MIGUEL HIDALGO LLAMAS

**PRIORITY
DOCUMENT**
SUBMITTED OR TRANSMITTED IN
COMPLIANCE WITH RULE 17.1(a) OR (b)



ACONDICION:

PATENTE DE INVENCIÓN MODELO DE UTILIDAD

TIPO DE SOLICITUD:

ADICIÓN A LA PATENTE

SOLICITUD DIVISIONAL

CAMBIO DE MODALIDAD

TRANSFORMACIÓN SOLICITUD PATENTE EUROPEA

PCT: ENTRADA FASE NACIONAL

(3) EXP. PRINCIPAL O DE ORIGEN:

MODALIDAD

Nº SOLICITUD

FECHA SOLICITUD

FECHA Y HORA DE PRESENTACIÓN EN LA O.E.P.M.

FECHA Y HORA PRESENTACIÓN EN LUGAR DISTINTO O.E.P.M.

(4) LUGAR DE PRESENTACIÓN: CÓDIGO

MADRID

28

SOLICITANTE (S): APELLIDOS O DENOMINACIÓN SOCIAL

BORATORIOS DEL DR. ESTEVE, S.A.

NOMBRE

NACIONALIDAD

CÓDIGO PAÍS

DNI/CIF

CNAE

PYME

4

DATOS DEL PRIMER SOLICITANTE:

DOMICILIO Avda. Mare de Deu de Montserrat, 221

LOCALIDAD BARCELONA

PROVINCIA BARCELONA

PAÍS RESIDENCIA ESPAÑA

NACIONALIDAD ESPAÑOLA

TELÉFONO

FAX

CORREO ELECTRÓNICO

CÓDIGO POSTAL 08041

CÓDIGO PAÍS ES

CÓDIGO PAÍS ES

INVENTOR (ES):

APELLIDOS

NOMBRE

NACIONALIDAD

CÓDIGO

DRRENS JOVER

ANTONI

PAÍS

AS PRIÓ

JOSEP

ES

ORDAL ZUERAS

ALBERTO

ES

EL SOLICITANTE ES EL INVENTOR

(9) MODO DE OBTENCIÓN DEL DERECHO:

EL SOLICITANTE NO ES EL INVENTOR O ÚNICO INVENTOR

INVENC. LABORAL

CONTRATO

SUCESIÓN

i) TÍTULO DE LA INVENCIÓN:

COMPUUESTOS SULFONAMIDICOS DERIVADOS DE BENZOXAZINONA, SU PREPARACION Y USO COMO MEDICAMENTOS.

ii) EFECTUADO DEPÓSITO DE MATERIA BIOLÓGICA:

SI

NO

iii) EXPOSICIONES OFICIALES: LUGAR

FECHA

iv) DECLARACIONES DE PRIORIDAD:

PAÍS DE ORIGEN

CÓDIGO PAÍS

NÚMERO

FECHA

4) EL SOLICITANTE SE ACOGE AL APLAZAMIENTO DE PAGO DE TASAS PREVISTO EN EL ART. 162. LEY 11/86 DE PATENTES

5) AGENTE /REPRESENTANTE: NOMBRE Y DIRECCIÓN POSTAL COMPLETA. (SI AGENTE P.I., NOMBRE Y CÓDIGO) (RELLÉNESE, ÚNICAMENTE POR PROFESIONALES)

ANGEL DAVILA BAZ 544/4 c/Goya No.11, 28001 MADRID

6) RELACIÓN DE DOCUMENTOS QUE SE ACOMPAÑAN:

DESCRIPCIÓN Nº DE PÁGINAS: 135

DOCUMENTO DE REPRESENTACIÓN

Nº DE REIVINDICACIONES: 53

JUSTIFICANTE DEL PAGO DE TASA DE SOLICITUD

DIBUJOS. Nº DE PÁGINAS:

HOJA DE INFORMACIÓN COMPLEMENTARIA

LISTA DE SECUENCIAS Nº DE PÁGINAS:

PRUEBAS DE LOS DIBUJOS

RESUMEN

CUESTIONARIO DE PROSPECCIÓN

DOCUMENTO DE PRIORIDAD

OTROS: DOC. DECLARACION

TRADUCCIÓN DEL DOCUMENTO DE PRIORIDAD

FIRMA DEL SOLICITANTE O REPRESENTANTE

A.

(VER COMUNICACIÓN)

FIRMA DEL FUNCIONARIO

OTIFICACIÓN SOBRE LA TASA DE CONCESIÓN:

Se le notifica que esta solicitud se considerará retirada si no procede al pago de la tasa de concesión; para el pago de esta tasa dispone de tres meses a contar desde la publicación del anuncio de la concesión en el BOPI, más los diez días que establece el art. 81 del R.D. 2245/1986.

MO. SR. DIRECTOR DE LA OFICINA ESPAÑOLA DE PATENTES Y MARCAS

formacion@oepm.es

C/ PANAMÁ, 1 • 28071 MADRID



MINISTERIO
DE CIENCIA
Y TECNOLOGÍA

Oficina Española
de Patentes y Marcas

NÚMERO DE SOLICITUD

P200301812

FECHA DE PRESENTACIÓN

PATENTE DE INVENCIÓN

MODELO DE UTILIDAD

(5) SOLICITANTES:

APELLIDOS O
DENOMINACIÓN SOCIAL

NOMBRE

NACIONALIDAD

CÓDIGO
PAÍS

DNI/CIF

CNAE

PI

7) INVENTORES:

APELLIDOS

NOMBRE

NACIONALIDAD

SAS ESCASANY

MARIA ANGELES

ESPAÑOLA

2) EXPOSICIONES OFICIALES:

LUGAR

FECHA

3) DECLARACIONES DE PRIORIDAD:

PAÍS DE ORIGEN

CÓDIGO
PAÍS

NÚMERO

FECHA



MINISTERIO
DE CIENCIA
Y TECNOLOGÍA



Oficina Española
de Patentes y Marcas

RECIBIDO EN

NÚMERO DE SOLICITUD

17200301812

FECHA DE PRESENTACIÓN

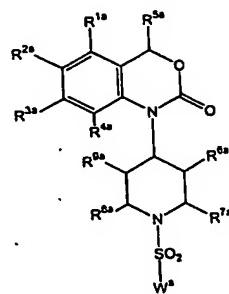
RESUMEN Y GRÁFICO

RESUMEN (Máx. 150 palabras)

COMPUESTOS SULFONAMIDICOS DERIVADOS DE BENZOXAZINONA, SU PREPARACION Y USO COMO MEDICAMENTOS.

La presente invención se refiere a compuestos sulfonamídicos derivados de benzoxazinona de fórmula general (I), un proceso para su preparación, un medicamento que comprenda estos compuestos y el uso de compuestos sulfonamídicos derivados de benzoxazinona para la preparación de medicamentos para regulación del receptor 5-HT6 así como para el tratamiento de trastornos relacionados.

GRÁFICO



(I)



(12)

SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCIÓN

(31) NÚMERO

DATOS DE PRIORIDAD

(32) FECHA

(33) PAÍS

(21) NÚMERO DE SOLICITUD

P200301812

(22) FECHA DE PRESENTACIÓN

(62) PATENTE DE LA QUE ES
DIVISORIA

(71) SOLICITANTE (S)

LABORATORIOS DEL DR. ESTEVE, S.A.

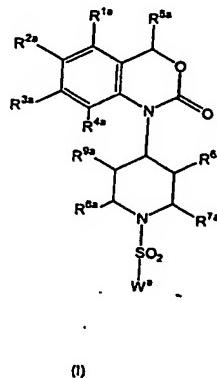
DOMICILIO Avda. Mare de Deu de Montserrat 221, 08041
BARCELONA

NACIONALIDAD ESPAÑOLA

(72) INVENTOR (ES) D. ANTONIO TORRENS JOVER., D. JOSEP MAS PRIÓ., D. ALBERTO DORDAL ZUERAS., D^a MARIA ANGELES FISAS ESCASANY.

(51) Int. Cl.

GRÁFICO (SÓLO PARA INTERPRETAR RESUMEN)



(54) TÍTULO DE LA INVENCIÓN

COMPUESTOS SULFONAMÍDICOS DERIVADOS DE BENZOXAZINONA,
SU PREPARACIÓN Y USO COMO MEDICAMENTOS.

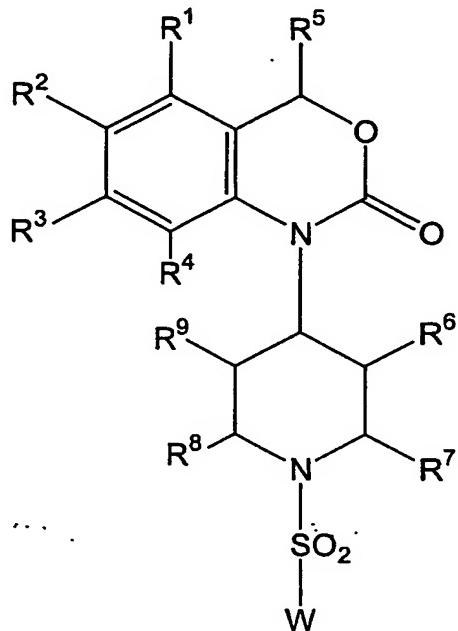
(57) RESUMEN

COMPUESTOS SULFONAMÍDICOS DERIVADOS DE BENZOXAZINONA, SU PREPARACIÓN Y USO COMO MEDICAMENTOS.

La presente invención se refiere a compuestos sulfonamídicos derivados de benzoxazinona de fórmula general (I), un proceso para su preparación, un medicamento que comprenda estos compuestos y el uso de compuestos sulfonamídicos derivados de benzoxazinona para la preparación de medicamentos para regulación del receptor 5-HT6 así como para el tratamiento de trastornos relacionados.

Compuestos sulfonamídicos derivados de benzoxazinona, su preparación y uso como medicamentos

La presente invención se refiere a compuestos sulfonamídicos derivados de
5 benzoxazinona de fórmula general (I),



(I)

- 10 un proceso para su preparación, un medicamento que comprenda estos compuestos y el uso de compuestos sulfonamídicos derivados de benzoxazinona para la preparación de medicamentos para regulación del receptor 5-HT₆ así como para el tratamiento de trastornos relacionados.
- 15 La superfamilia de receptores de serotonina (5-HT) comprende 7 clases (5-HT₁-5-HT₇) que abarcan 14 subclases humanas [D. Hoyer, et al., *Neuropharmacology*, 1997, 36, 419]. El receptor 5-HT₆ ha sido el último receptor de serotonina identificado por clonación molecular tanto en rata [F.J. Monsma, et al., *Mol. Pharmacol.*, 1993, 43, 320; M. Ruat, et al., *Biochem. Biophys. Res. Commun.*, 1993, 193, 268] como en humanos [R. Kohen, et al.,

J. Neurochem., 1996, 66, 47]. Los compuestos con afinidad al receptor 5-HT₆ son útiles en el tratamiento de diversos trastornos del Sistema Nervioso Central y del aparato Gastrointestinal como el síndrome del intestino irritable. Los compuestos con afinidad al receptor 5-HT₆ son útiles para el tratamiento de la ansiedad, depresión y trastornos cognitivos de la memoria [M. Yoshioka, et al., Ann. NY Acad. Sci., 1998, 861, 244; A. Bourson, et al., Br. J. Pharmacol., 1998, 125, 1562; D.C. Rogers, et al., Br. J. Pharmacol. Suppl., 1999, 127, 22P; A. Bourson, et al., J. Pharmacol. Exp. Ther., 1995, 274, 173; A.J. Sleight, et al., Behav. Brain Res., 1996, 73, 245; T.A. Branchek, et al., Annu. Rev. Pharmacol. Toxicol., 2000, 40, 319; C. Routledge, et al., Br. J. Pharmacol., 2000, 130, 1606]. Se ha demostrado que los antipsicóticos típicos y atípicos para el tratamiento de la esquizofrenia tienen una elevada afinidad por los receptores 5-HT₆ [B.L. Roth, et al., J. Pharmacol. Exp. Ther., 1994, 268, 1403; C.E. Glatt, et al., Mol. Med., 1995, 1, 398; F.J. Mosma, et al., Mol. Pharmacol., 1993, 43, 320; T. Shinkai, et al., Am. J. Med. Genet., 1999, 88, 120]. Los compuestos con afinidad al receptor 5-HT₆ son útiles para el tratamiento de la hiperkinesia infantil (ADHD, attention deficit / hyperactivity disorder) [W.D. Hirst, et al., Br. J. Pharmacol., 2000, 130, 1597; C. Gérard, et al., Brain Research, 1997, 746, 207; M.R. Pranzatelli, Drugs of Today, 1997, 33, 379].

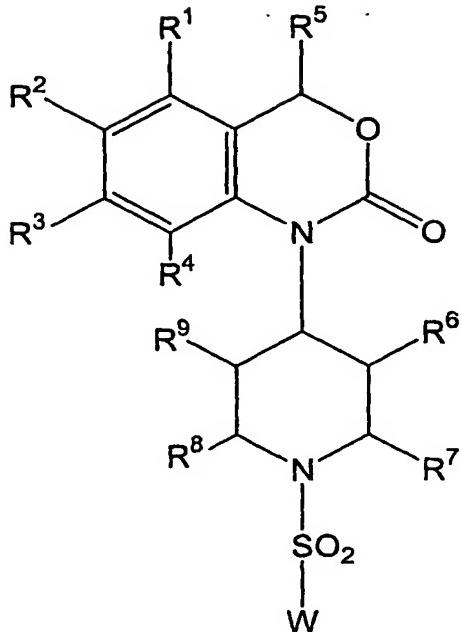
Además, se ha demostrado que el receptor 5-HT₆ también desempeña un papel en la ingestión de alimentos [Neuropharmacology, 41, 2001, 210-219]. Los trastornos alimentarios, particularmente la obesidad, son una amenaza seria y creciente para la salud de las personas de todos los grupos de edad, ya que incrementan el riesgo de desarrollar otras enfermedades serias, incluso mortales, como la diabetes y las enfermedades coronarias.

Así pues, fue objeto de la presente invención proporcionar nuevos compuestos que fueran particularmente adecuados como principios activos en medicamentos, preferiblemente en medicamentos para la regulación de receptores 5-HT₆, para la mejora de la cognición, para la profilaxis y/o tratamiento de trastornos alimentarios, trastornos del sistema nervioso central,

trastornos del aparato digestivo, como el síndrome del intestino irritable, ansiedad, pánico, depresión, trastornos cognitivos de la memoria, trastornos de demencia senil, como Morbus Alzheimer, Morbus Parkinson y/o Morbus Huntington, esquizofrenia, psicosis, hiperkinesia infantil, ADHC (attention deficit, hyperactivity disorders) y otros trastornos mediados por 5-HT₆ en humanos y animales, preferiblemente en mamíferos, más preferiblemente en humanos.

Se ha hallado que los compuestos sulfonamídicos derivados de benzoxazinona de fórmulas generales (I) y (la) dados a continuación muestran afinidad por el receptor 5-HT₆. Estos compuestos son por tanto también adecuados para la fabricación de un medicamento para la mejora de la cognición, para la profilaxis y/o tratamiento de trastornos de la ingestión alimenticia, particularmente para la regulación del apetito, para el mantenimiento, aumento o reducción del peso corporal, para la profilaxis y/o tratamiento de obesidad, bulimia, anorexia, caquexia o diabetes de tipo II (Diabetes mellitus no insulino-dependiente), preferiblemente diabetes de tipo II, que es causada por obesidad, trastornos del sistema nervioso central, trastornos del aparato digestivo, como el síndrome del intestino irritable, ansiedad, pánico, depresión, trastornos cognitivos de la memoria, trastornos de demencia senil, como Morbus Alzheimer, Morbus Parkinson y Morbus Huntington, esquizofrenia, psicosis, hiperkinesia infantil, ADHC (attention deficit, hyperactivity disorders) y otros trastornos mediados por 5-HT₆ particularmente en humanos y animales, preferiblemente en mamíferos, más preferiblemente en humanos.

Así, un aspecto de la presente invención son compuestos sulfonamídicos derivados de benzoxazinona de fórmula general (I),



5

en la cual

R¹, R², R³, R⁴ son cada uno seleccionados independientemente del grupo consistente en hidrógeno, halógeno, un radical alifático, lineal o ramificado, saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, un radical cicloalifático saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente conteniendo al menos un heteroátomo como miembro del anillo, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno opcionalmente al menos monosustituido, y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido, o un radical arilo o heteroarilo opcionalmente al menos monosustituido, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno opcionalmente al menos monosustituido y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al

menos monosustituido, un grupo nitro, ciano, -OR¹⁰, -O(C=O)R¹¹, -(C=O)OR¹¹, -SR¹², -SOR¹², -SO₂R¹², -NH-SO₂R¹², -SO₂NH₂ y -NR¹³R¹⁴,

R⁵ representa hidrógeno, un radical alifático opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado o un radical cicloalifático saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente conteniendo al menos un heteroátomo como miembro del anillo,

R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ son cada uno seleccionados independientemente del grupo consistente en hidrógeno, un radical alifático opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado, un radical cicloalifático saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente conteniendo al menos un heteroátomo como miembro del anillo, un grupo ciano y un grupo -COOR¹⁵,

W representa un radical alifático opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado, un radical cicloalifático saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente conteniendo al menos un heteroátomo como miembro del anillo, que puede enlazarse vía un grupo alquílico opcionalmente al menos monosustituido, y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido,

un radical heteroarilo opcionalmente al menos monosustituido, que puede enlazarse vía un grupo alquílico opcionalmente monosustituido y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclico opcionalmente al menos monosustituido, un radical arilo monocíclico, opcionalmente al menos monosustituido, que se condensa con un sistema de anillos mono o policíclico opcionalmente al menos monosustituido y que puede enlazarse vía un grupo alquílico opcionalmente al menos monosustituido,

un grupo $NR^{16}R^{17}$,

un grupo COR^{18} ,

5 o un radical fenilo, que es al menos monosustituido por uno de los sustituyentes seleccionados del grupo consistente en:

2,2,2,-Trifluoroetoxi-, C₂₋₆-Alquenil-, 1,3-Dihidro-1-oxo-2H-isoadol-2-il-, N-Ftalimidinil-, [(2-cloro-1,3-tiazol-5-il)-metoxi, 5-Etil-2-metil-3-furoato, C₁₁₋₂₀-alquilo, 1,3-Dioxo-2-azaspiro[4,4]non-2-il-, pirazolilo, (1,3-oxazol-5-il)-, (5-Metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-, difluorometoxi, diclorometoxi, 1-pirrolidinilsulfonilo, morfolinsulfonilo, 2-metil-4-pirimidinilo, un grupo fenoxi, que es al menos monosustituido por C₁₋₅-alcoxi, un grupo fenilo, que es al menos monosustituido por uno de los sustituyentes seleccionados del grupo consistente en nitro, C₁₋₅-alcoxi, F, Cl, Br, alquiloC₁₋₅ al menos parcialmente fluorado, C₁₋₅-alquilo al menos parcialmente clorado, [(2-Cloro-1,3-tiazol-5-il)-metoxi]-, -(C=O)-H y -(C=O)-C₁₋₅-alquilo, un grupo piridinilo, que es al menos monosustituido por C₁₋₅-alcoxi, un grupo piridiniloxi, que es al menos monosustituido por C₁₋₅-alcoxi, un grupo fenoxi, que es al menos disustituido y un grupo piridiniloxi, que es al menos disustituido,

con la condición de que W no represente furilo no sustituido, tienilo no sustituido o tienilo sustituido por un sustituyente seleccionado del grupo consistente en C₁₋₅-alcoxcarbonilo, C₁₋₅-alquilcarbonilo, carboxilo y piridilo, pirrolilo no sustituido, naftilo no sustituido, indolilo no sustituido, tetrahidronaftilo no sustituido, piridilo sustituido o no sustituido, pirazinilo no sustituido, quinolinilo no sustituido, pirrolilo sustituido por C₁₋₅-alquilo, ciclohexilo no sustituido o ciclohexilo sustituido por uno o dos miembros seleccionados del grupo consistente en oxo, hidroxilo, C₁₋₅-alcoxilo, C₁₋₅-alcoxi-carboniloamino-C₁₋₅ alquilo y amino-C₁₋₅ alquilo,

R¹⁰ representa hidrógeno, un radical alifático, lineal o ramificado, saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, un radical cicloalifático saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente conteniendo al menos un heteroátomo como miembro del anillo, que puede
5 enlazarse vía un grupo alquíleno opcionalmente al menos monosustituido, y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos
opcionalmente al menos monosustituido, o un radical arilo o heteroarilo
opcionalmente al menos monosustituido, que puede enlazarse vía un grupo
alquíleno opcionalmente al menos monosustituido y/o puede condensarse con
10 un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos
monosustituido,

R¹¹ representa hidrógeno, un radical alifático, lineal o ramificado, saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, un radical cicloalifático
15 saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente conteniendo al menos un heteroátomo como miembro del anillo, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno opcionalmente al menos monosustituido; y/o
puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos
opcionalmente al menos monosustituido, o un radical arilo o heteroarilo
20 opcionalmente al menos monosustituido, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno opcionalmente al menos monosustituido y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido,

25 R¹² representa un radical alifático, lineal o ramificado, saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, un radical cicloalifático saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente
conteniendo al menos un heteroátomo como miembro del anillo, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno opcionalmente al menos monosustituido, y/o
30 puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos
opcionalmente al menos monosustituido, o un radical arilo o heteroarilo
opcionalmente al menos monosustituido, que puede enlazarse vía un grupo

alquíleno opcionalmente al menos monosustituido y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido,

- 5 R^{13} y R^{14} son cada uno seleccionados independientemente del grupo consistente en hidrógeno, un radical alifático, lineal o ramificado, saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, un radical cicloalifático saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente contenido al menos un heteroátomo como miembro del anillo, que puede
10 enlazarse vía un grupo alquíleno opcionalmente al menos monosustituido, y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos
 opcionalmente al menos monosustituido, o un radical arilo o heteroarilo
 opcionalmente al menos monosustituido, que puede enlazarse vía un grupo
 alquíleno opcionalmente al menos monosustituido y/o puede condensarse con
15 un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos
 monosustituido,

 o bien R^{13} y R^{14} junto con el átomo puente de nitrógeno forman un anillo
 heterocíclico saturado, insaturado o aromático, opcionalmente al menos
20 monosustituido, que puede contener al menos un heteroátomo adicional como
 miembro del anillo,

25 R^{15} representa hidrógeno, un radical alifático, lineal o ramificado, saturado o
 insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, un radical cicloalifático
 saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente
 contenido al menos un heteroátomo como miembro del anillo, o un radical
 arilo o heteroarilo opcionalmente al menos monosustituido, que puede
 enlazarse vía un grupo alquíleno opcionalmente al menos monosustituido y/o
 puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos
30 opcionalmente al menos monosustituido,

R¹⁶ representa un radical alifático opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado,

R¹⁷ representa un radical alifático opcionalmente al menos monosustituido, 5 saturado o insaturado, lineal o ramificado, y

R¹⁸ representa un radical arilo opcionalmente al menos monosustituido,

10 opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, su racemato o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, en cualquier relación de mezcla, o una de sus sales correspondientes, o un solvato correspondiente.

15 Según la presente invención, un sistema de anillos mono o policíclico significa un sistema de anillos hidrocarbonados mono o policíclico que puede ser saturado, insaturado o aromático. Si el sistema de anillos es policíclico, cada uno de sus diferentes anillos puede mostrar un grado de saturación distinto, es decir, puede ser saturado, insaturado o aromático. Opcionalmente, 20 cada anillo del sistema de anillos mono o policíclico puede contener uno o más heteroátomos como miembros del anillo, que pueden ser idénticos o diferentes y que pueden seleccionarse preferiblemente del grupo consistente en N, O, S y P, más preferiblemente del grupo consistente en N, O y S. Preferiblemente el sistema de anillos policíclico puede comprender dos anillos condensados. Los 25 anillos del sistema de anillos mono o policíclico tienen preferiblemente 5 o 6 miembros.

Si uno o más de los residuos R¹-R¹⁷ y W representa un radical alifático, que es sustituido por uno o más sustituyentes, a menos que se defina de otra forma, 30 cada uno de estos sustituyentes puede seleccionarse preferiblemente del grupo consistente en hidroxi, halógeno, C₁₋₄-alcoxi ramificado o lineal, C₁₋₄-perfluoroalcoxi ramificado o lineal, C₁₋₄-perfluoroalquilo ramificado o lineal,

amino, carboxi, amido, ciano, nitro, $-SO_2NH_2$, $-CO-C_{1-4}$ -alquilo, $-SO-C_{1-4}$ -alquilo, $-SO_2-C_{1-4}$ -alquilo, $-NH-SO_2-C_{1-4}$ -alquilo, en el cual el C_{1-4} -alquilo puede en cada caso ser ramificado o lineal, un radical fenilo o naftilo no sustituido o al menos monosustituido y un radical furanilo, tienilo, pirrolilo, imidazolilo, pirazolilo, 5 piridinilo, pirimidinilo, quinolinilo e isoquinolinilo no sustituido o al menos monosustituido, seleccionado más preferiblemente del grupo consistente en hidroxi, F, Cl, Br, metoxi, etoxi, CF_3 y un radical fenilo no sustituido. Si cualquiera de los sustituyentes mencionados es en sí al menos monosustituido, dichos sustituyentes pueden preferiblemente seleccionarse del 10 grupo consistente en F, Cl, metilo y metoxi.

Si uno o más de los residuos R^1-R^{15} representa o comprende un radical cicloalifático, que es sustituido por uno o más sustituyentes, a menos que se defina de otra forma, cada uno de estos sustituyentes puede seleccionarse 15 preferiblemente del grupo consistente en hidroxi, halógeno, C_{1-4} -alquilo ramificado o lineal, C_{1-4} -alcoxi ramificado o lineal, C_{1-4} -perfluoroalcoxi ramificado o lineal, fenoxy, benzoilo, ciclohexilo, C_{1-4} -perfluoroalquilo ramificado o lineal, $-NR^A R^B$ en el cual R^A , R^B son cada uno independientemente seleccionados del grupo consistente en H, un radical alquilo C_{1-4} ramificado o 20 lineal, $-CH_2-CH_2-OH$ y fenilo, carboxi, amido, ciano, nitro, $-SO_2NH_2$, $-CO-C_{1-4}$ -alquilo, $-CO-OC_{1-4}$ -alquilo, $-SO-C_{1-4}$ -alquilo, $-SO_2-C_{1-4}$ -alquilo, $-NH-SO_2-C_{1-4}$ -alquilo, en el cual C_{1-4} -alquilo puede en cada caso ser ramificado o lineal, fenilo o naftilo no sustituido o al menos monosustituido y radical furanilo, tienilo, pirrolilo, imidazolilo, pirazolilo, piridinilo, pirimidinilo, quinolinilo e isoquinolinilo 25 no sustituido o al menos monosustituido, seleccionarse más preferiblemente del grupo consistente en hidroxi, F, Cl, Br, metilo-, etilo-, metoxi, etoxi, benzoilo, fenoxy, ciclohexilo, $-CF_3$, $-CO-CH_3$, $-CO-OCH_3$, $-NR^A R^B$ en el cual R^A , R^B son cada uno independientemente seleccionados del grupo consistente en H, un radical alquilo- C_{1-4} ramificado o lineal, $-CH_2-CH_2-OH$ y fenilo, y un radical 30 fenilo no sustituido. Si cualquiera de los sustituyentes mencionados es en sí al menos monosustituido, dichos sustituyentes pueden preferiblemente seleccionarse del grupo consistente en F, Cl, metilo y metoxi.

Si uno o más de los residuos R^1-R^4 , $R^{10}-R^{15}$ y W comprende un grupo alquíleno, que es sustituido por uno o más sustituyentes, a menos que se defina de otra forma, cada uno de estos sustituyentes puede seleccionarse preferiblemente del grupo consistente en hidroxi, halógeno, C_{1-4} -alcoxi ramificado o lineal, C_{1-4} -perfluoroalcoxi ramificado o lineal, C_{1-4} -perfluoroalquilo ramificado o lineal, amino, carboxi, amido, ciano, nitro, $-SO_2NH_2$, $-CO-C_{1-4}$ -alquilo, $-SO-C_{1-4}$ -alquilo, $-SO_2-C_{1-4}$ -alquilo, $-NH-SO_2-C_{1-4}$ -alquilo, en el cual C_{1-4} -alquilo puede ser ramificado o lineal, un radical fenilo o naftilo no sustituido o al menos monosustituido y un radical furanilo, tienilo, pirrolilo, imidazolilo, pirazolilo, piridinilo, pirimidinilo, quinolinilo e isoquinolinilo no sustituido o al menos monosustituido, seleccionarse más preferiblemente del grupo consistente en hidroxi, F, Cl, Br, metoxi, etoxi, CF_3 y fenilo no sustituido. Si cualquiera de los sustituyentes mencionados es en sí al menos monosustituido, dichos sustituyentes pueden preferiblemente seleccionarse del grupo consistente en F, Cl, metilo y metoxi.

Si uno o más de los residuos R^1-R^4 y $R^{10}-R^{15}$ comprende un sistema de anillo mono o policíclico, que es sustituido por uno o más sustituyentes, a menos que se defina de otra forma, cada uno de estos sustituyentes puede seleccionarse preferiblemente del grupo consistente en hidroxi, halógeno, C_{1-4} -alquilo ramificado o lineal, C_{1-4} -alcoxi ramificado o lineal, C_{1-4} -perfluoroalcoxi ramificado o lineal, C_{1-4} -perfluoroalquilo ramificado o lineal, amino, carboxi, amido, ciano, ceto, nitro, $-SO_2NH_2$, $-CO-C_{1-4}$ -alquilo, $-SO-C_{1-4}$ -alquilo, $-SO_2-C_{1-4}$ -alquilo, $-NH-SO_2-C_{1-4}$ -alquilo, en el cual C_{1-4} -alquilo puede ser ramificado o lineal, un radical fenilo o naftilo no sustituido o al menos monosustituido y un radical furanilo, tienilo, pirrolilo, imidazolilo, pirazolilo, piridinilo, pirimidinilo, quinolinilo e isoquinolinilo no sustituido o al menos monosustituido, más preferiblemente del grupo consistente en hidroxi, F, Cl, Br, metilo-, etilo-, metoxi, etoxi, CF_3 , ceto, ciano y un radical fenilo no sustituido. Si cualquiera de los sustituyentes mencionados es en sí al menos monosustituido, dichos sustituyentes pueden preferiblemente seleccionarse del grupo consistente en F, Cl, metilo y metoxi.

Si uno o más de los residuos R^1-R^4 , $R^{10}-R^{15}$ y R^{18} representa o comprende un radical arilo, que es sustituido por uno o más sustituyentes, a menos que se defina de otra forma, cada uno de estos sustituyentes puede seleccionarse preferiblemente del grupo consistente en hidroxi, halógeno, C_{1-4} -alcoxi

5 ramificado o lineal, C_{1-4} -alquilo ramificado o lineal, C_{1-4} -perfluoroalcoxi ramificado o lineal, fenoxi no sustituido o al menos monosustituido, benzoilo no sustituido o al menos monosustituido, ciclohexilo, C_{1-4} -perfluoroalquilo ramificado o lineal, $NR^A R^B$ en el cual R^A , R^B son cada uno independientemente seleccionados del grupo consistente en H, un radical alquilo C_{1-4} ramificado o

10 lineal, $-CH_2-CH_2-OH$ y Fenilo, carboxi, amido, ciano, $-CH(OH)(fenilo)$, nitro, $-SO_2NH_2$, $-CO-C_{1-4}$ -alquilo, $-CO-OC_{1-4}$ -alquilo, $-SO-C_{1-4}$ -alquilo, $-SO_2-C_{1-4}$ -alquilo, $-NH-SO_2-C_{1-4}$ -alquilo, en el cual C_{1-4} -alquilo puede ser ramificado o lineal, un radical fenilo o naftilo no sustituido o al menos monosustituido y un radical furanilo, tienilo, pirrolilo, imidazolilo, pirazolilo, piridinilo, pirimidinilo,

15 quinolinilo e isoquinolinilo no sustituido o al menos monosustituido, seleccionarse más preferiblemente del grupo consistente en hidroxi; F, Cl, Br, metilo-, etilo-, ciano, $-CH(OH)(fenilo)$, metoxi, etoxi, benzoilo no sustituido o al menos monosustituido, fenoxi no sustituido o al menos monosustituido, ciclohexilo, CF_3 , $-CO-CH_3$, $-CO-OCH_3$, $-NR^A R^B$ en el cual R^A , R^B son cada uno

20 independientemente seleccionados del grupo consistente en H, un radical alquilo C_{1-4} ramificado o lineal, $-CH_2-CH_2-OH$ y Fenilo, y un radical fenilo no sustituido. Si cualquiera de los sustituyentes mencionados es en sí al menos monosustituido, dichos sustituyentes pueden preferiblemente seleccionarse del grupo consistente en F, Cl, metilo y metoxi.

25

Si uno o más de los residuos R^1-R^4 y $R^{10}-R^{15}$ representa o comprende un radical heteroarilo, que es sustituido por uno o más sustituyentes, a menos que se defina de otra forma, cada uno de estos sustituyentes puede seleccionarse preferiblemente del grupo consistente en hidroxi, halógeno, C_{1-4} -alcoxi

30 ramificado o lineal, C_{1-4} -alquilo ramificado o lineal, C_{1-4} -perfluoroalcoxi ramificado o lineal, fenoxi no sustituido o al menos monosustituido, benzoilo no sustituido o al menos monosustituido, ciclohexilo, C_{1-4} -perfluoroalquilo

ramificado o lineal, $NR^A R^B$ en el cual R^A , R^B son cada uno independientemente seleccionados del grupo consistente en H, un radical alquilo C₁₋₄ ramificado o lineal, -CH₂-CH₂-OH y fenilo, carboxi, amido, ciano, nitro, -CH(OH)(fenilo), -SO₂NH₂, -CO-C₁₋₄-alquilo, -CO-OC₁₋₄-alquilo, SO-C₁₋₄-alquilo, SO₂-C₁₋₄-alquilo, -

5 NH-SO₂-C₁₋₄-alquilo, en el cual C₁₋₄-alquilo puede ser ramificado o lineal, un radical fenilo o naftilo no sustituido o al menos monosustituido y un radical furanilo, tienilo, pirrolilo, imidazolilo, pirazolilo, piridinilo, pirimidinilo, quinolinilo e isoquinolinilo no sustituido o al menos monosustituido, seleccionado más preferiblemente del grupo consistente en hidroxi, F, Cl, Br, metilo-, etilo-, ciano, 10 metoxi, etoxi, benzoilo no sustituido o al menos monosustituido, fenoxy no sustituido o al menos monosustituido, ciclohexilo, CF₃, -CH(OH)(fenilo), -CO-CH₃, -CO-OCH₃, -NR^AR^B en el cual R^A, R^B son cada uno independientemente seleccionados del grupo consistente en H, un radical alquilo C₁₋₄ ramificado o lineal, -CH₂-CH₂-OH y fenilo, y un radical fenilo no sustituido. Si cualquiera de 15 los sustituyentes mencionados es en sí al menos monosustituido, dichos sustituyentes pueden preferiblemente seleccionarse del grupo consistente en F, Cl, metilo y metoxi.

Si R¹³ y R¹⁴ forman un anillo heterocíclico, que es sustituido por uno o más 20 sustituyentes, a menos que se defina de otra forma, cada uno de estos sustituyentes puede seleccionarse preferiblemente del grupo consistente en hidroxi, halógeno, C₁₋₄-alcoxi ramificado o lineal, C₁₋₄-alquilo ramificado o lineal, C₁₋₄-perfluoroalcoxi ramificado o lineal, C₁₋₄-perfluoroalquilo ramificado o lineal, amino, carboxi, amido, ciano, nitro, -SO₂NH₂, -CO-C₁₋₄-alquilo, -SO-C₁₋₄-alquilo, 25 -SO₂-C₁₋₄-alquilo, -NH-SO₂-C₁₋₄-alquilo, en el cual C₁₋₄-alquilo puede ser ramificado o lineal, un radical fenilo o naftilo no sustituido o al menos monosustituido y un radical furanilo, tienilo, pirrolilo, imidazolilo, pirazolilo, piridinilo, pirimidinilo, quinolinilo e isoquinolinilo no sustituido o al menos monosustituido, seleccionarse más preferiblemente del grupo consistente en hidroxi, F, Cl, Br, metoxi, etoxi, metilo-, CF₃ y un radical fenilo no sustituido. Si 30 cualquiera de los sustituyentes mencionados es en sí al menos

monosustituido, dichos sustituyentes pueden preferiblemente seleccionarse del grupo consistente en F, Cl, metilo y metoxi.

Si R¹³ y R¹⁴ forman un anillo heterocíclico, que contiene uno o más

5 heteroátomos adicionales como miembros del anillo, a menos que se defina de otra forma, cada uno de estos heteroátomos puede preferiblemente seleccionarse del grupo consistente en N, O y S, más preferiblemente del grupo consistente en N y O.

10 Si uno o más de los residuos R¹-R¹⁵ y W representa un radical cicloalifático, que contiene uno o más heteroátomos como miembros del anillo, a menos que se defina de otra forma, cada uno de estos heteroátomos puede preferiblemente seleccionarse del grupo consistente en N, O, S y P, más preferiblemente del grupo consistente en N, O y S.

15 Si uno o más de los residuos R¹-R⁴ y R¹⁰-R¹⁵ y W representa o comprende un radical heteroarilo, que contiene uno o más heteroátomos como miembros del anillo, a menos que se defina de otra forma, cada uno de estos heteroátomos puede preferiblemente seleccionarse del grupo consistente en N, O, S y P, más preferiblemente del grupo consistente en N, O y S.

20 Si W representa o comprende un radical cicloalifático, un radical heteroarilo, un radical arilo y/o un sistema de anillos mono o policíclico, que es sustituido por uno o más sustituyentes, a menos que se defina de otra forma, cada uno de estos sustituyentes puede seleccionarse preferiblemente del grupo consistente en hidroxi, nitro, carboxi, ciano, ceto, halógeno, C₁₋₂₀-alquilo, C₁₋₄-alquilo parcialmente fluorado, C₁₋₄-alquilo parcialmente clorado, C₁₋₄-alquilo parcialmente bromado, C₁₋₅-alcoxi, C₁₋₄-alcoxi parcialmente fluorado, C₁₋₄-alcoxi parcialmente clorado, C₁₋₄-alcoxi parcialmente bromado, C₂₋₆-alquenilo, SO₂-C₁₋₄-alquilo, -(C=O)-C₁₋₅-alquilo, -(C=O)-O-C₁₋₅-alquilo, -(C=O)-Cl, -S-C₁₋₄-alquilo, -(C=O)-H, -NH-(C=O)-NH-C₁₋₅-alquilo, -(C=O)-C₁₋₄-perfluoroalquilo, -NR^AR^B, en el cual R^A y R^B son independientemente seleccionados del grupo consistente

en H, C₁₋₄-alquilo y fenilo, NH-(C=O)-C₁₋₅-alquilo, -C₁₋₅-alquilen-(C=O)-C₁₋₅-alquilo, (1,3-Dihidro-1-oxo-2H-isoindol-2-ilo), N-ftalimidinil-, (1,3-Dioxo-2-azaspiro[4,4]-non-2-ilo, fenilo sustituido o no sustituido, -SO₂-fenilo, fenoxy, piridinilo, piridiniloxi, pirazolilo, pirimidinilo, pirrolidinilo, -SO₂-pirrolidinilo, morfolinilo, SO₂-morpholinilo, tiadiazolilo, oxadiazolilo, oxazolilo, tiazolilo, isoxazolilo, O-CH₂-tiazolilo, -, NH-fenilo, y -C₁₋₄-Alquilen-NH-(C=O)-fenilo, más preferiblemente del grupo consistente en hidroxi, nitro, carboxi, ciano, ceto, F, Cl, Br, I, C₁₋₁₂-alquilo, CH₂F, CHF₂, CF₃, CH₂Cl, CH₂Cl₂, CCl₃, CH₂Br, CHBr₂, CBr₃, OCF₃, OCHF₂, OCH₂F, O-CH₂-CF₃, vinilo, SO₂-CH₃, -(C=O)-CH₃, -(C=O)-

10 C₂H₅, -(C=O)-O-CH₃, -(C=O)-O-C₂H₅, -(C=O)-Cl, -S-CH₃-, -(C=O)-H, -NH-(C=O)-NH-CH₃, -(C=O)-CF₃, dimetilamino, dietilamino, di-n-propilamino, di-isopropilamino, di-n-butilamino, di-tert-butilamino, NH-(C=O)-CH₃, -CH₂-(C=O)-CH₃, -CH₂-(C=O)-C₂H₅, (1,3-Dihidro-1-oxo-2H-isoindol-2-ilo), N-Ftalimidinil-, (1,3-Dioxo-2-azaspiro[4,4]-non-2-ilo, fenilo sustituido o no sustituido, -SO₂-fenilo, fenoxy, piridinilo, piridiniloxi, pirazolilo, pirimidinilo, pirrolidinilo, -SO₂-pirrolidinilo, morpholinilo, SO₂-morpholinilo, tiadiazolilo, oxadiazolilo, oxazolilo, tiazolilo, isoxazolilo; O-CH₂-tiazolilo, NH-fenilo, y -CH₂-NH-(C=O)-fenilo.

15 Si cualquiera de los sustituyentes mencionados en sí mismo es sustituido por uno o más sustituyentes, dichos sustituyentes pueden preferiblemente seleccionarse del grupo consistente en halógeno, nitro, ciano, hidroxi, -(C=O)-C₁₋₄-alquilo, C₁₋₄-alquilo, C₁₋₄-alquilo al menos parcialmente fluorado, C₁₋₄-alquilo al menos parcialmente clorado, C₁₋₄-alquilo al menos parcialmente bromado, -S-C₁₋₄-alquilo, -C(=O)-O-C₁₋₅-alquilo, -(C=O)-CH₂-F, -(C=O)-CH₂-Cl, -(C=O)-CH₂-Br, preferiblemente del grupo consistente en F, Cl, Br, CH₂F, CHF₂, 25 CF₃, CH₂Cl, CHCl₂, CCl₃, CH₂Br, CHBr₂, CBr₃, nitro, ciano, hidroxi, -(C=O)-CH₃, CH₃, C₂H₅, -S-CH₃, -C(=O)-O-CH₃, -C(=O)-O-C₂H₅, -(C=O)-CH₂-F, -(C=O)-CH₂-Cl y -(C=O)-CH₂-Br.

Compuestos preferidos de fórmula general (I) son aquellos en que R¹, R², R³, R⁴ son cada uno independientemente seleccionados del grupo consistente en H, F, Cl, Br, un radical alifático C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado, un radical cicloalifático C_{3-C₈} saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente conteniendo al menos un heteroátomo como miembro del anillo, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno C_{1-C₆} opcionalmente al menos monosustituido, y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido, un radical arilo o heteroarilo de 5 o 6 miembros opcionalmente al menos monosustituido, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclico opcionalmente al menos monosustituido, un grupo nitro, ciano, -OR¹⁰, -OC(=O)R¹¹, -SR¹², -SOR¹², -SO₂R¹², -NH-SO₂R¹², -SO₂NH₂ y -NR¹³R¹⁴,

preferiblemente seleccionados del grupo consistente en H, F, Cl, Br, un radical alifático C₁₋₃ opcionalmente al menos monosustituido, ramificado o lineal, saturado, un radical cicloalifático C₅ o C₆ saturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente conteniendo al menos un heteroátomo como miembro del anillo, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno C₁ or C₂ opcionalmente al menos monosustituido, un grupo nitro, ciano, -OR¹⁰, -OC(=O)R¹¹, -SR¹² y -NR¹³R¹⁴,

más preferiblemente seleccionados del grupo consistente en H, F, Cl, CH₃, CH₂CH₃, CF₃, CF₂CF₃, ciclopentilo, ciclohexilo, nitro, ciano y -OR¹⁰, y R⁵-R¹⁸ y W tienen la significación definida anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, sus racematos o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, en cualquier relación de mezcla, o sus sales correspondientes, o solvatos correspondientes.

También preferidos son compuestos de fórmula general (I), en el cual R⁵ representa hidrógeno, un radical alifático C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado o un radical cicloalifático C_{3-C₈} saturado o insaturado, opcionalmente al menos

- 5 monosustituido, opcionalmente conteniendo al menos un heteroátomo como miembro del anillo,

preferiblemente representa H o un radical alquilo C₁₋₃ ramificado o lineal,

- 10 más preferiblemente H, CH₃ o CH₂CH₃,

y R^{1-R⁴}, R^{6-R¹⁸} y W tienen la significación indicada anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, sus racematos o en forma de una mezcla de al 15 menos dos de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, en cualquier relación de mezcla, o sus sales correspondientes, o solvatos correspondientes.

Compuestos preferidos de fórmula general (I) son también aquellos en los 20 cuales R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ son cada uno independientemente seleccionados del grupo consistente en hidrógeno, un radical alifático C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado, un radical cicloalifático C_{3-C₈} saturado o insaturado, opcionalmente al menos 25 monosustituido, opcionalmente conteniendo al menos un heteroátomo como miembro del anillo, un grupo ciano y un grupo COOR¹⁵,

preferiblemente seleccionados del grupo consistente en H, un radical alquilo C₁₋₃ ramificado o lineal, un ciano y un grupo COOR¹⁵,

- 30 más preferiblemente del grupo consistente en H, CH₃, CH₂CH₃ y un grupo ciano,

y R^1-R^5 , $R^{10}-R^{18}$ y W tienen la significación indicada anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, sus racematos o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o 5 diasterómeros, en cualquier relación de mezcla, o sus sales correspondientes, o solvatos correspondientes.

También preferidos son compuestos de fórmula general (I), en los cuales W representa un radical alquilo C₁₋₂₀, lineal o ramificado, opcionalmente al menos 10 monosustituido, un grupo naftilo, que es al menos monosustituido, un grupo quinolinilo, que es al menos monosustituido, un grupo pirrolilo, que es al menos monosustituido por un sustituyente cualquiera excepto por radical alquilo C₁₋₅, un grupo tiazolil-, benzo[b]-tiofenilo, benzo[b]-furanilo, isoquinolinilo, tetrahidroisoquinolinilo, pirazolilo, isoazolilo, cromanilo, benzotiadiazolilo, 15 imidazolilo, benzofurazanilo, dibenzo[b,d]-furanilo, benzoxadiazolilo, imidazo[2,1-b]-tiazolil-, antracenilo, coumarinilo, 2,3-Dihidro-1,4-benzodioxinilo, 2,3-Dihidrobenzo[b]furanilo, 3,4-Dihidro-2H-1,4-benzoxazinilo, 3,4-Dihidro-2H-1,5-benzodioxepinilo, Benzotiazolil-, Imidazo[1,2-a]-piridinilo respectivamente 20 opcionalmente al menos monosustituidos, un grupo cromanilo, un grupo isatinilo, un grupo pentametildihydrobenzofuranilo, un grupo ciclopropil- o ciclopentilo opcionalmente al menos monosustituido, un grupo 2-(1,3-Dioxo-1,3-dihidro-isoindol-2-il)-etilo-, un grupo tienilo, que es al menos monosustituido por uno o más sustituyentes independientemente seleccionados del grupo consistente en F, Cl, Br, C₁₋₅-alcoxi-, CF₃, -SO₂-C₁₋₅- 25 alquilo y un grupo benzoiloaminometilo, un grupo fenilsulfonilo, un grupo isoxazolilo, un grupo benzoamidometilo, un grupo pirimidilo, un grupo tiazolilo, un grupo pirazolilo, un grupo fenilo, un grupo 1,2,4-tiadiazolilo, un 1,3-oxazolilo y 1,2,4-oxadiazolilo, respectivamente opcionalmente al menos monosustituido, un grupo furilo, que es al menos monosustituido por uno o más sustituyentes 30 independientemente seleccionados del grupo consistente en un radical alquilo C₁₋₅, que puede ser al menos parcialmente fluorado o clorado, un fenilo opcionalmente al menos monosustituido y un grupo (C=O)-O-C₁₋₅-alquilo,

un grupo NR¹⁶R¹⁷,

un grupo COR¹⁸,

5

o un radical fenilo, que es al menos monosustituido por uno de los sustituyentes seleccionados del grupo consistente en:

2,2,2-Trifluoroetoxi-, C₂₋₆-Alquenil-, 1,3-Dihidro-1-oxo-2H-isoindol-2-il-, N-Ftalimidinil-, [(2-cloro-1,3-tiazol-5-il)-metoxi, 5-Etil-2-metil-3-furoato, C₁₁₋₂₀-alquilo, 1,3-Dioxo-2-azaspiro[4,4]non-2-il-, pirazolilo, (1,3-oxazol-5-il)-, (5-Metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-, difluorometoxi, diclorometoxi, 1-pirrolidinilsulfonilo, morfolinsulfonilo, 2-metil-4-pirimidinilo, un grupo fenoxy, que es al menos monosustituido por C₁₋₅-alcoxi, un grupo fenilo, que es al menos monosustituido por uno de los sustituyentes seleccionados del grupo consistente en nitro, C₁₋₅-alcoxi, -F, Cl, Br, alquiloC₁₋₅ al menos parcialmente fluorado, C₁₋₅-alquilo al menos parcialmente clorado; [(2-Cloro-1,3-tiazol-5-il)-metoxi]-, -(C=O)-H y -(C=O)-C₁₋₅-alquilo, un grupo piridinilo, que es al menos monosustituido por C₁₋₅-alcoxi, un grupo piridiniloxi, que es al menos monosustituido por C₁₋₅-alcoxi, un grupo fenoxy, que es al menos disustituido y un grupo piridiniloxi, que es al menos disustituido,

más preferiblemente W representa un grupo seleccionado del grupo consistente en 5-Dimetilamino-1naftil, 2-Aacetamido-4-metil-5-tiazolil-,

25 Trifluorometil-, Triclorometil-, Isopropil-, Metil-, 2,2,2-Trifluoroethyl-, Etil-, Hexadecil-, 2-Cloroethyl-, n-Propil-, 3-Cloro-Propil-, n-Butil-, Diclorometil-, Clorometil-, Dodecil-, 1-Octil-, 6-(p-toluidino)-2naftil-, 4,5-Dibromo-tiofen-2-il-, cloruro de benzoilo-2-il-, 1-Octadecil-, 4-Bromo-2,5-dicloro-tiofen-3-il-, 2,5-Dicloro-tiofen-3-il-, 5-Cloro-tiofen-2-il-, 1-Decil-, 3,5-Dicloro-4-(2-cloro-4-nitrofenoxy)-fenil-, 2,3-Diclorotiofen-5-il, 3-Bromo-2-cloro-tiofen-5-il-, 3-Bromo-5-cloro-tiofen-2-il-, 2-(Benzoilaminometil)-tiofen-5-il-, 4-(Fenil-sulfonil)-tiofen-2-il-, 2-Fenil-sulfonil-tiofen-5-il-, 2-[1-Metil-5-(trifluorometil)pirazol-3-il]-tiofen-5-il-, 5-

Cloro-1,3-dimetilopirazol-4-il-, 3,5-Dimetilisoxazol-4-il-, 4-(2-Cloro-6-nitrofenoxi)-fenil-, 4-(3-cloro-2-cianofenoxy)-fenil, 2-(2,4-Diclorofenoxy)fenil-, 2,4-Dimetil-1,3-tiazol-5-il-, Metil-metano-sulfoniil-, 2,5-Bis-(2,2,2-trifluoroetoxi)-fenil-, 5-(Di-n-propilamino)-1-naftil-, 2,2,5,7,8-Pentametil-croman-6-il-, 5-Cloro-4-nitrotiofen-2-il-, 2,1,3-Benzotiadiazol-4-il-, 1-Metil-imidazol-4-il-, Benzofurazan-4-il-, 5-(Isoxazol-3-il)-tiofen-2-il-, Vinil-fenil-4-il-, 5-Dicloro-metil-furan-2-il-, 5-Bromotiofen-2-il-, 5-(4-Clorobenzoamidometil)-tiofen-2-il-, Dibenzo[b,d]-furan-2-il-, 5-Cloro-3-metilbenzo[b]-tiofen-2-il-, 3-Metoxi-4-(metoxicarbonil)-tiofen-2-il-, 5-[2-(Metiltio)-pirimidin-4-il]-tiofen-2-il-, 4-Cloro-2,1,3-Benzoxadiazol-7-il-, 5-Cloro-2,1,3-Benzoxadiazol-4-il-, 6-Cloro-imidazo(2,1-b)-tiazol-5-il-, 3-Metil-benzo[b]-tiofeno-2-il-, 4-[[3-Cloro-5-(trifluorometil)-2-piridil-fenil, 4-Metoxi-2,3,6-trimetilbenzoilo, 5-Cloro-1-naftil-, 5-Cloro-2-naftil-, 9,10-Dibromoantracen-2-il-, Isoquinolin-5-il-, 4'-Nitro-bifenil-4-il-, (1,3-Dihidro-1-oxo-2H-isoindol-2-il)-4-fenil-, 5-(2-Metil-1,3-tiazol-4-il)-tiofen-2-il-, 5-(1-Metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-il]-tiofen-2-il-, 5-[5-Trifluorometil]-isoxazol-3-il]-tiofen-2-il-, p-Dodecil-fenil-, 4-[(3-Ciano-4-metoxi-2-piridinilo)oxi]-fenil-, 4-(N-ftalimidinil)-fenil-, 4,2,3,4-Tetrahidro-2-(trifluoroacetil)-isoquinolina-7-il-, 1,2-Dimetilimidazol-4-il-, 2,2,4,6,7-Pentametildihidrobenzofuran-5-il-, 4-Cloro-1-naftil-, 2,5-Dicloro-4-nitro-tiofen-3-il-, 4-(4-Metoxi-fenoxy)-fenil-, [4-(3,5-Diclorofenoxy)fenil]-, [4-(3,4-diclorofenoxy)-fenil-, [4-(3,5)-Bis-(trifluorometilfenoxy)fenil-, 3-(2-Metoxi-fenoxy)-fenil-, 3-(4-Metoxi-fenil)-fenil-, 3-(4-Cloro-fenil)-fenil-, 3-(3,5-Dicloro-fenil)-fenil-, 3-(3,4-Dicloro-fenil)-fenil-, 3-(4-Fluorofenil)-fenil-, 3-[4-(Trifluorometil)-fenil]-fenil-, 3-[3,5-Bis-(Trifluorometil)-fenil]-fenil-, 4-(2-Metoxi-fenoxy)-fenil-, 4-(2-Metil-fenoxy)-fenil-, 4-(4-Metoxi-fenoxy)-fenil-, 4-(4-Clorofenil)-fenil-, 4-(3,5-Diclorofenil)-fenil-, 4-(3,4-Diclorofenil)-fenil-, 4-(4-Fluorofenil)-fenil-, 4-[4-(Trifluorometil)-fenil]-fenil-, 4-[3,5-Bis-(Trifluorometil)-fenil]-fenil-, Ciclopropil-, 2-(2-Clorofenil)-2-feniletil-, 2-(2-Trifluorometilfenil)-2-feniletil-, 5-[4-Ciano-1-metil-5-(metiltio)-1H-pirazol-3-il]-tiofeno-2-il-, 3-Ciano-2,4-bis-(2,2,2-trifluorotoxi)-fenil-, 4-[(2-Cloro-1,3-tiazol-5-il)-metoxi]-fenil-, 2-(1,3-Dioxo-1,3-dihidro-isoindol-2-il)-etil-, 5-Iodo-1-naftil-, Etil-2,5-dimetil-1-fenilopirrol-4-carboxilato-3-il-, Etil-2-metil-1,5-difenil-1H-pirrol-3-carboxilato-4-il-, Etil-5-(4-clorofenil)-2-metil-3-furoato-4-il, Etil-5-(4-clorofenil)-2-metil-1-fenil-3-carboxilato-4-il-, Etil-2,5-dimetil-3-furoato-4-il-, 3-Cloro-4-(1,3-

dioxo-2-Azaspiro[4,4]non-2-il)-fenil-, Coumarin-6-il, 3-(4-Metoxi-fenoxy)-fenil-, [3-3,4-Dicloro-fenoxy])fenil-, [3-(3,4-Dicloro-fenoxy)-fenil]-3,5-Bis-trifluorometilfenoxifenil-, 2,2-Difeniletil-, 4-Fenil-5-(trifluorometil)-tiofen-3-il-, Metil-4-fenil-5-(trifluorometil)-tiofen-2-carboxilato-3-il-, Metil-1,2,5-trimetilpirrol-3-carboxilato-4-il-, 4-Fluoro-1-naftil-, 5-Fluoro-3-metilbenzo[b]-tiofen-2-il-, Metil-2,5-dimetil-3-furoato-4-il-, Metil-2-furoato-5-il-, Metil-2-metil-3-furoato-5-il-, Metil-1-metil-1H-pirrol-2-carboxilato-5-il-, 2-(5-Cloro-1,2,4-tiadiazol-3-il)-tiofeno-5-il-, 1,3,5-Trimetil-1H-pirazol-4-il-, Pentafluoroetoxitetrafluoroetyl-, 5-(5-Isoxacil)-tiofeno-2-il-, 5-(5-Isoxazol-il)-2-furil-, 5-Metil-2,1,3-benzotiadiazol-4-il-, 2,3-Dihidro-1,4-benzodioxine-6-il-, 4-Metil-1-naftil-, 5-Metil-2-(trifluorometil)-3-furil-, 2,3-Dihidrobenzo[b]furan-5-il-, 1-Benzotiofen-3-il-, 4-Metil-3,4-dihidro-2H-1,4-Benzoxazin-7-il-, 5-Metil-1-fenil-1H-pirazol-4-il-, 6-Morfolin-3-piridinil-, 4-(1H-Pirazol-1-il)-fenil-, 6-Fenoxy-3-piridil-, 3,4-Dihidro-2H-1,5-benzodioxepin-7-il-, 5-(1,3-Oxazol-5-il)-2-tienil-, 4-(1,3-Oxazol-5-il)-fenil-, 5-Metil-4-isoxazolil-, 2,1,3-Benzotiadiazol-5-il-, 5-Acetamido-1-naftil-, 3-Metil-8-quinolinil-, 1,3-Benzotiazol-6-il-, 2-Morfolin-3-piridil-, 2,5-Dimetil-3-tienil-, 5-[5-(Clorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]-2-tienil-, Etil-3-[5-il-2-tienilo]1,2,4-oxadiazol-5-carboxilato-, 3-(5-Metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-fenil-, 4-(Difluorometoxi)-fenil-, 3-(Difluorometoxi)-fenil-, 2,2-Dimetil-6-cromanil-, Etil-3,5-dimetil-1H-pirrol-2-carboxilato-4-il-, Imidazo[1,2-a]piridin-3-il-, 3-(1,3-Oxazol-5-il)-fenil-, Etil-5-[4-il]-fenil]-2-metil-3-furoato, 1-Pirrolidinilfenilsulfonil-, Metil-5-il-4-metil-2-tiofen-carboxilato, Metil-3-il-4-(isopropilsulfonil)-2-tiofeno, 7-Clorocromon-3-il-, 4'-Bromobifenil-4-il-, 4'-Acetilobifenil-4-il-, 4'-Bromo-2'-fluoro-bifenil-4-il-, 1-Metil-5-isatinil-, ácido-2-cloro-3-tiofencarboxilico-5-il-, 2-Metoxi-5-(N-ftalimidinil)-fenil-, 1-Benzotiofen-2-il-, Morfolinfenilsulfonil- y 3-(2-Metil-4-pirimidinil)-fenil- y R¹-R¹⁵ tienen la significación indicada anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, sus racematos o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, en cualquier relación de mezcla, o sus sales correspondientes, o solvatos correspondientes.

También preferidos son compuestos de fórmula general (I), en los cuales R¹⁰ representa hidrógeno, un radical alifático C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado, un radical cicloalifático C_{3-C₈} saturado o insaturado, opcionalmente al menos

5 monosustituido, opcionalmente contenido al menos un heteroátomo como miembro del anillo, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno C_{1-C₆} opcionalmente al menos monosustituido, y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido, o un radical arilo o heteroarilo de 5 o 6 miembros opcionalmente al menos monosustituido, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno C_{1-C₆} 10 opcionalmente al menos monosustituido y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclico opcionalmente al menos monosustituido,

15 preferiblemente H, un radical alquilo C₁₋₄ lineal o ramificado, ciclohexilo o un radical fenilo,

más preferiblemente H, CH₃, C₂H₅ o fenilo,

20 y R^{1-R⁹}, R^{12-R¹⁸} y W tienen la significación indicada anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, sus racematos o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, en cualquier relación de mezcla, o sus sales correspondientes, o solvatos correspondientes.

25 También preferidos son compuestos de fórmula general (I), en los cuales R¹¹ representa hidrógeno, un radical alifático C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado, un radical cicloalifático C_{3-C₈} saturado o insaturado, opcionalmente al menos 30 monosustituido, opcionalmente contenido al menos un heteroátomo como miembro del anillo, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno C_{1-C₆} opcionalmente al menos monosustituido, y/o puede condensarse con un

- sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido, o un radical arilo o heteroarilo de 5 o 6 miembros opcionalmente al menos monosustituido, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclico opcionalmente al menos monosustituido,
- 5 preferiblemente H, un radical alquilo C₁₋₄ lineal o ramificado, ciclohexilo o un radical fenilo, más preferiblemente H, CH₃, C₂H₅ o fenilo,
- 10 y R¹-R¹⁰, R¹²-R¹⁸ y W tienen la significación indicada anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, sus racematos o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, en cualquier relación de mezcla, o sus sales correspondientes, 15 o solvatos correspondientes.
- También preferidos son compuestos de fórmula general (I), en los cuales R¹² representa un radical alifático C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado, un radical cicloalifático C_{3-C8} 20 saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente conteniendo al menos un heteroátomo como miembro del anillo, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno C_{1-C6} opcionalmente al menos monosustituido, y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido, o un radical arilo o 25 heteroarilo de 5 o 6 miembros, al menos monosustituido, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclico opcionalmente al menos monosustituido,
- 30 preferiblemente representa H, un radical alquilo C₁₋₄, ciclohexilo o un radical fenilo, más preferiblemente H, CH₃, C₂H₅ o fenilo,

y R^1-R^{11} , $R^{13}-R^{18}$ y W tienen la significación indicada anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, sus racematos o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o 5 diasterómeros, en cualquier relación de mezcla, o sus sales correspondientes, o solvatos correspondientes.

También preferidos son compuestos de fórmula general (I), en los cuales R^{13} y 10 R^{14} son cada uno independientemente seleccionados del grupo consistente en hidrógeno, un radical alifático C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado, un radical cicloalifático C_{3-C₈} saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente 15 conteniendo al menos un heteroátomo como miembro del anillo, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno C_{1-C₆} opcionalmente al menos monosustituido, y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido; o un radical arilo o hetroarilo de 5 o 6 miembros, al menos monosustituido, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido y/o puede 20 condensarse con un sistema de anillos mono o policíclico opcionalmente al menos monosustituido,

preferiblemente son cada uno independientemente seleccionados del grupo consistente en H, un radical alquilo C₁₋₄ lineal o ramificado, ciclohexilo y un radical fenilo,

25 más preferiblemente son cada uno independientemente seleccionados del grupo consistente en H, CH₃, C₂H₅ y fenilo,

30 y R^1-R^{12} , $R^{15}-R^{18}$ y W tienen la significación indicada anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, sus racematos o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o

diasterómeros, en cualquier relación de mezcla, o sus sales correspondientes, o solvatos correspondientes.

También preferidos son compuestos de fórmula general (I), en los cuales R¹³ y
5 R¹⁴ junto con el átomo puente de nitrógeno forman un anillo heterocíclico de 5
o 6 miembros saturado, insaturado o aromático, que puede ser al menos
monosustituido y/o contener al menos un heteroátomo más como miembro del
anillo,

10 preferiblemente forman un grupo piperidina o morfolina no sustituido,

y R¹-R¹², R¹⁵-R¹⁸ y W tienen la significación indicada anteriormente,
opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente
enantiómeros o diasterómeros, sus racematos o en forma de una mezcla de al
15 menos dos de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o
diasterómeros, en cualquier relación de mezcla, o sus sales correspondientes,
o solvatos correspondientes.

También preferidos son compuestos de fórmula general (I), en los cuales R¹⁵
20 representa hidrógeno, un radical alifático C₁₋₆ opcionalmente al menos
monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado , un radical
cicloalifático C_{3-C₈} saturado o insaturado, opcionalmente al menos
monosustituido, opcionalmente conteniendo al menos un heteroátomo como
miembro del anillo, o un radical arilo o heteroarilo de 5 o 6 miembros, al menos
25 monosustituido, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno C₁₋₆
opcionalmente al menos monosustituido y/o puede condensarse con un
sistema de anillos mono o policíclico opcionalmente al menos monosustituido,

30 preferiblemente representa H, un radical alquilo C₁₋₄, ciclohexilo o un radical
fenilo,

más preferiblemente representa H, CH₃, C₂H₅ o fenilo,

y R¹-R¹⁴, R¹⁶ a R¹⁸ y W tienen la significación indicada anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, sus racematos o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, en cualquier relación de mezcla, o sus sales correspondientes, o solvatos correspondientes.

10 También preferidos son compuestos de fórmula general (I), en los cuales R^{16} representa un radical alifático C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado.

preferiblemente un radical alquilo C₁₋₃ lineal o ramificado, saturado, no sustituido.

15

y R^1 - R^{15} , R^{17} , R^{18} y W tienen la significación indicada anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, sus racematos o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, en cualquier relación de mezcla, o sus sales correspondientes, o solvatos correspondientes.

25 También preferidos son compuestos de fórmula general (I), en los cuales R¹⁷ representa un radical alifático C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado.

preferiblemente un radical alquilo C₁₋₃ lineal o ramificado, saturado, no sustituido.

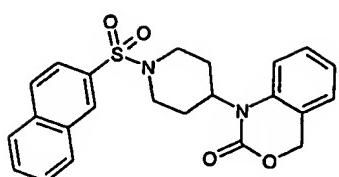
más preferiblemente un radical metilo

y R¹-R¹⁶, R¹⁸ y W tienen la significación indicada anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, sus racematos o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, en cualquier relación de mezcla, o sus sales correspondientes, o solvatos correspondientes.

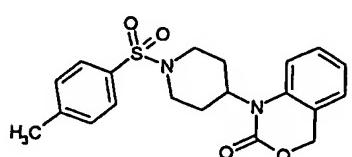
Particularmente preferidos son compuestos de fórmula general (I)

seleccionados de la siguiente lista A:

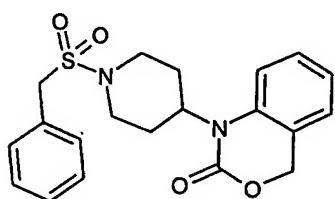
Lista A:



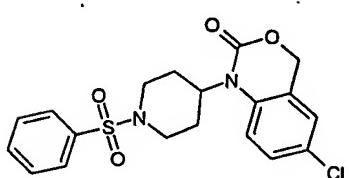
1-[1-(Naphthalene-2-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



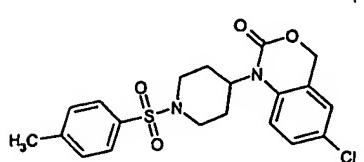
1-[1-(Toluene-4-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



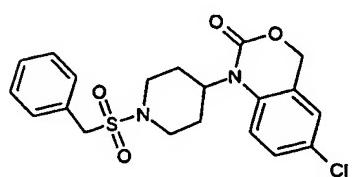
1-(1-Phenylmethanesulfonyl-piperidin-4-yl)-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



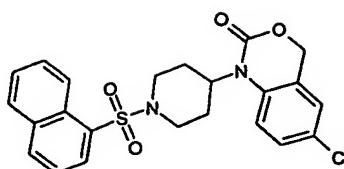
1-(1-Benzenesulfonyl-piperidin-4-yl)-6-chloro-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



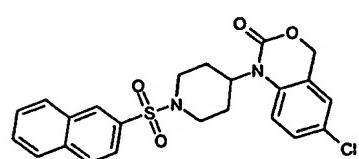
6-Chloro-1-[1-(toluene-4-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



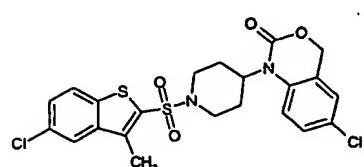
6-Chloro-1-(1-phenylmethanesulfonyl-piperidin-4-yl)-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



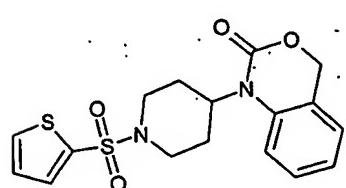
6-Chloro-1-[1-(naphthalene-1-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



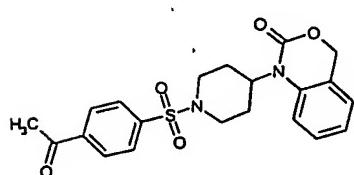
6-Chloro-1-[1-(naphthalene-2-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



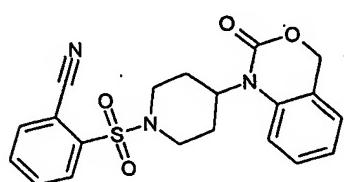
6-Chloro-1-[1-(5-chloro-3-methylbenzo[b]thiophene-2-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



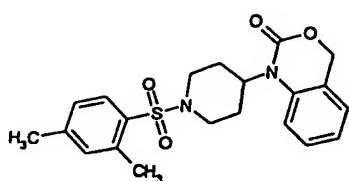
6-Chloro-1-[1-(5-chloro-3-methylbenzo[b]thiophene-2-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



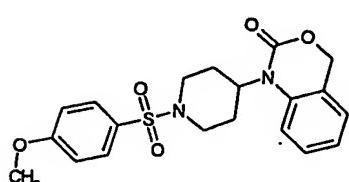
1-[1-(4-Acetyl-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



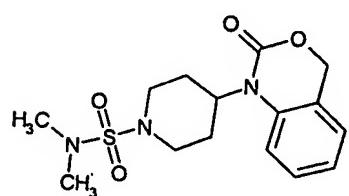
2-[4-(2-Oxo-4H-benzo[d][1,3]oxazin-1-yl)-piperidine-1-sulfonyl]-benzonitrile



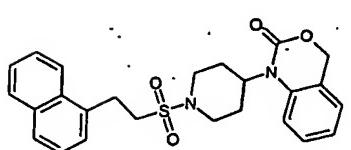
1-[1-(2,4-Dimethyl-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



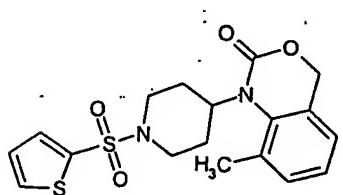
1-[1-(4-Methoxy-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



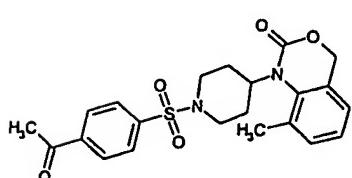
4-(2-Oxo-4H-benzo[d][1,3]oxazin-1-yl)-piperidine-1-sulfonic acid dimethylamide



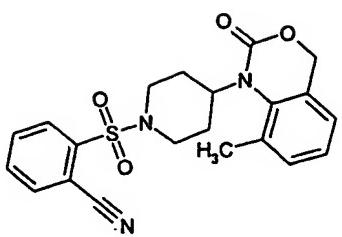
1-[1-(2-Naphthalen-1-yl-ethanesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



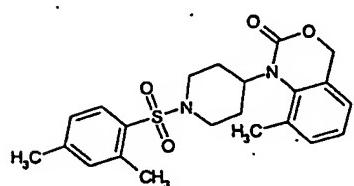
8-Methyl-1-[1-(thiophene-2-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



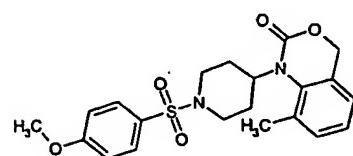
1-[1-(4-Acetyl-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-8-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



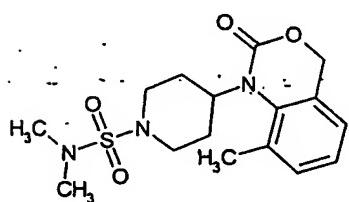
2-[4-(8-Methyl-2-oxo-4H-benzo[d][1,3]oxazin-1-yl)-piperidine-1-sulfonyl]-benzonitrile



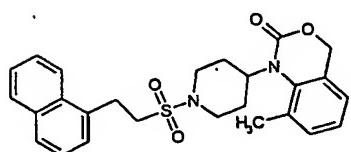
1-[1-(2,4-Dimethyl-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-8-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



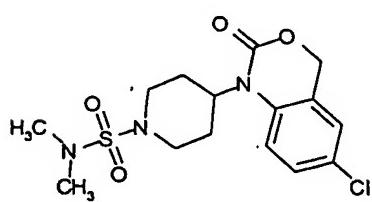
1-[1-(4-Methoxy-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-8-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



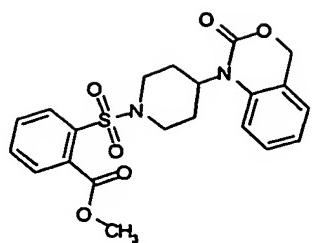
4-(8-Methyl-2-oxo-4H-benzo[d][1,3]oxazin-1-yl)-piperidine-1-sulfonic acid dimethylamide



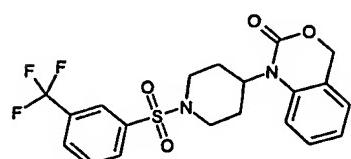
8-Methyl-1-[1-(2-naphthalen-1-yl-ethanesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



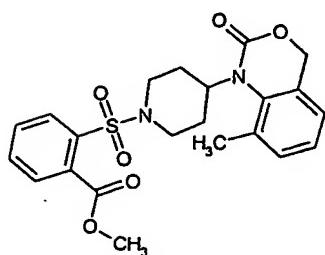
4-(6-Chloro-2-oxo-4H-benzo[d][1,3]oxazin-1-yl)-piperidine-1-sulfonic acid dimethylamide



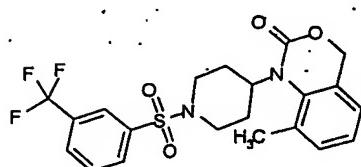
2-[4-(2-Oxo-4H-benzo[d][1,3]oxazin-1-yl)-piperidine-1-sulfonyl]-benzoic acid methyl ester



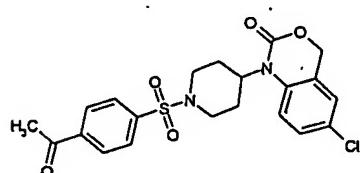
1-[1-(3-Trifluoromethyl-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



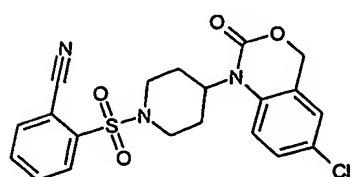
2-[4-(8-Methyl-2-oxo-4H-benzo[d][1,3]oxazin-1-yl)-piperidine-1-sulfonyl]-benzoic acid methyl ester



8-Methyl-1-[1-(3-trifluoromethyl-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one

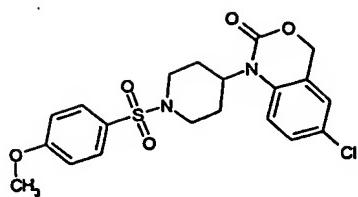


1-[1-(4-Acetyl-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-chloro-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one

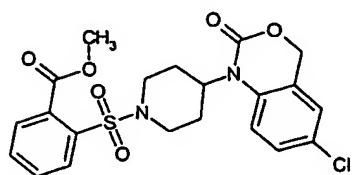


2-[4-(6-Chloro-2-oxo-4H-benzo[d][1,3]oxazin-1-yl)-piperidine-1-sulfonyl]-benzonitrile

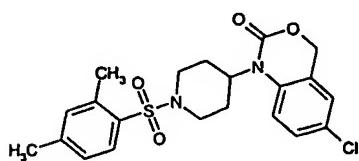
6-Chloro-1-[1-(4-methoxybenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



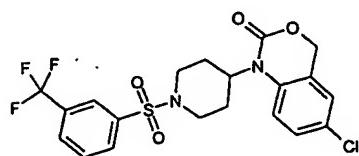
2-[4-(6-Chloro-2-oxo-4H-benzo[d][1,3]oxazin-1-yl)-piperidine-1-sulfonyl]-benzoic acid methyl ester



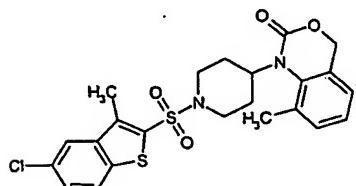
6-Chloro-1-[1-(2,4-dimethylbenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



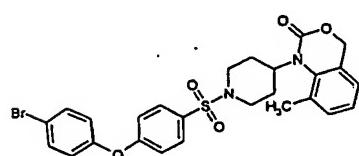
6-Chloro-1-[1-(3-trifluoromethylbenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one

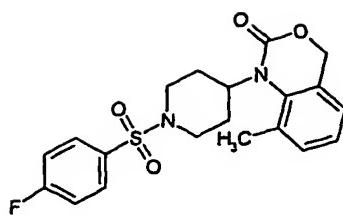


1-[1-(5-Chloro-3-methylbenzo[b]thiophene-2-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-8-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one

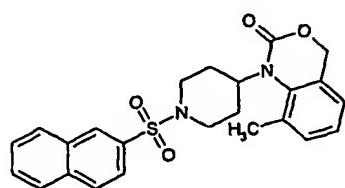


1-{1-[4-(4-Bromo-phenoxy)benzenesulfonyl]-piperidin-4-yl}-8-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one

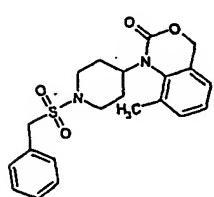




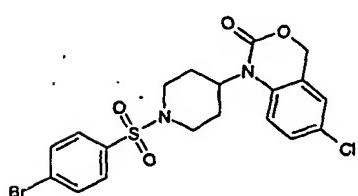
1-[1-(4-Fluoro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-8-methyl-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



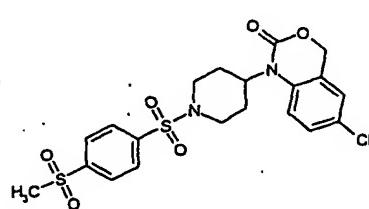
8-Methyl-1-[1-(naphthalene-2-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



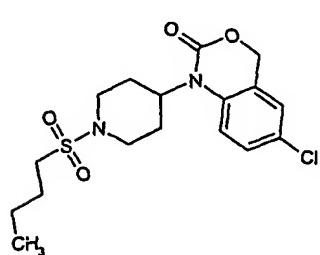
8-Methyl-1-(1-phenylmethanesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



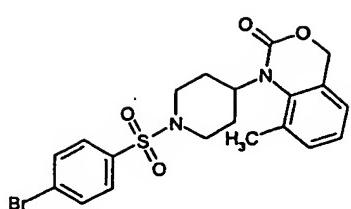
1-[1-(4-Bromo-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-chloro-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



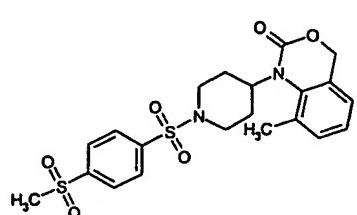
6-Chloro-1-[1-(4-methanesulfonyl-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



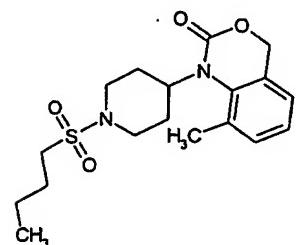
1-[1-(Butane-1-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-chloro-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



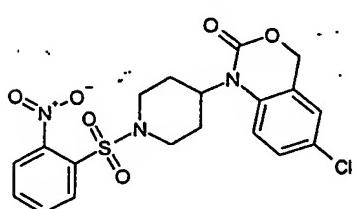
1-[1-(4-Bromo-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-8-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



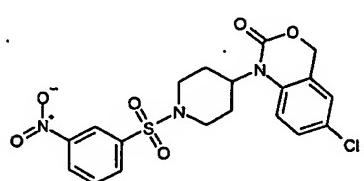
1-[1-(4-Methanesulfonyl-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-8-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



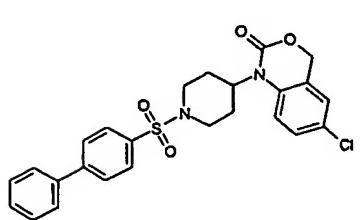
1-[1-(Butane-1-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-8-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



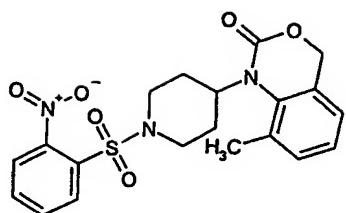
6-Chloro-1-[1-(2-nitro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



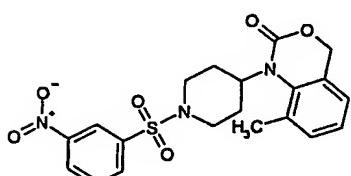
6-Chloro-1-[1-(3-nitro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



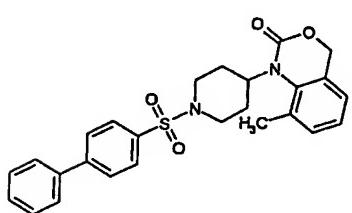
1-[1-(Biphenyl-4-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-chloro-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



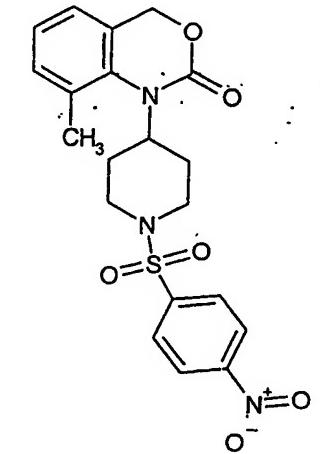
8-Methyl-1-[1-(2-nitrobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



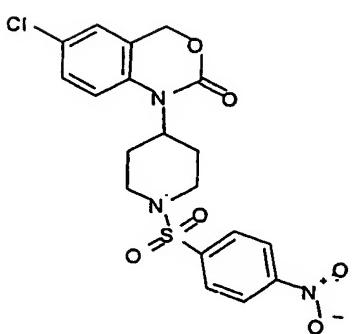
8-Methyl-1-[1-(3-nitrobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



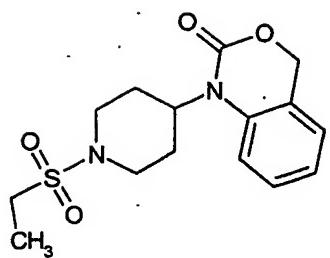
1-[1-(Biphenyl-4-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-8-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



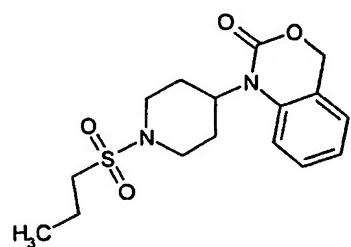
8-Methyl-1-[1-(4-nitrobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



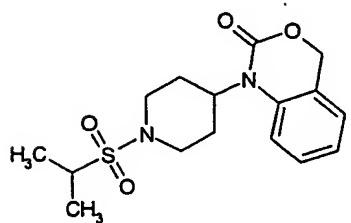
6-Chloro-1-[1-(4-nitrobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



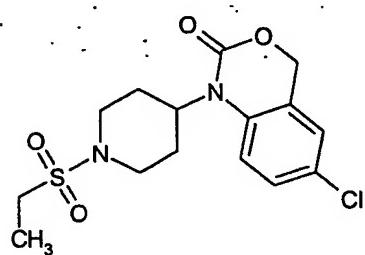
1-(1-Ethan磺酰-piperidin-4-yl)-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



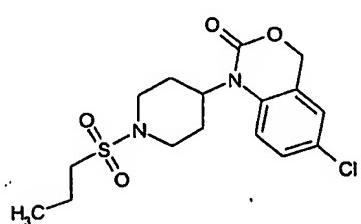
1-[1-(Propane-1-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



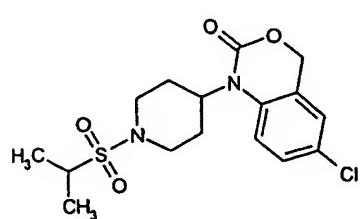
1-[1-(Propane-2-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



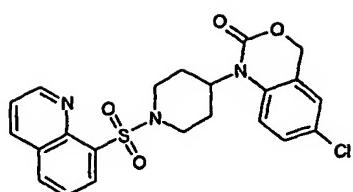
6-Chloro-1-(1-ethanesulfonyl)-piperidin-4-yl)-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



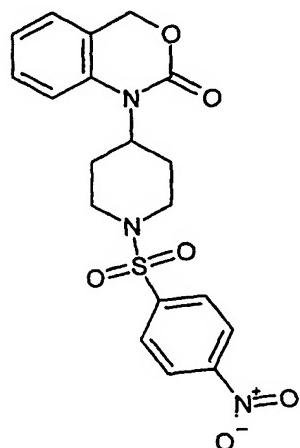
6-Chloro-1-[1-(propane-1-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



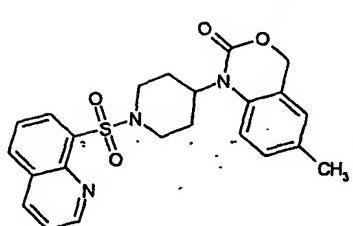
6-Chloro-1-[1-(propane-2-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



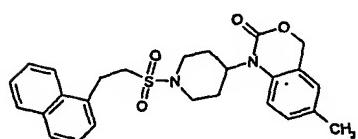
6-Chloro-1-[1-(quinoline-8-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



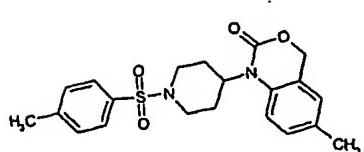
1-[1-(4-Nitro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



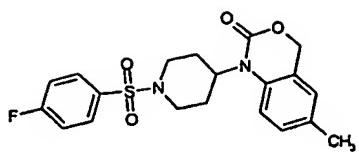
6-Methyl-1-[1-(quinoline-8-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



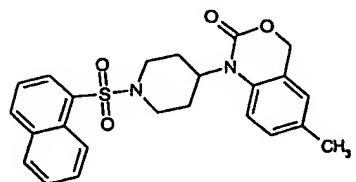
6-Methyl-1-[1-(2-naphthalen-1-yl-ethanesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



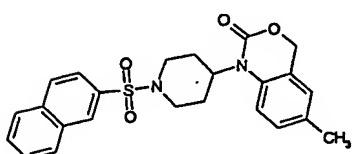
6-Methyl-1-[1-(toluene-4-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



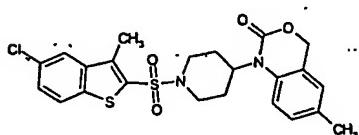
1-[1-(4-Fluoro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



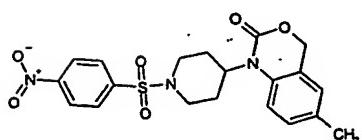
6-Methyl-1-[1-(naphthalene-1-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



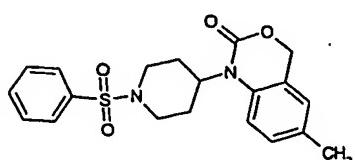
6-Methyl-1-[1-(naphthalene-2-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



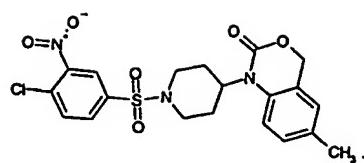
1-[1-(5-Chloro-3-methyl-benzo[b]thiophene-2-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



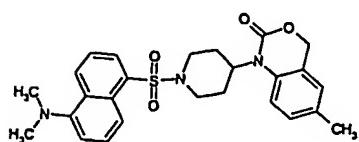
6-Methyl-1-[1-(4-nitro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



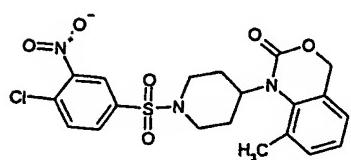
1-(1-Benzenesulfonyl-piperidin-4-yl)-6-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



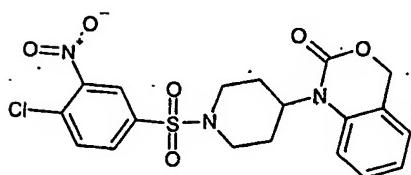
1-[1-(4-Chloro-3-nitrobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



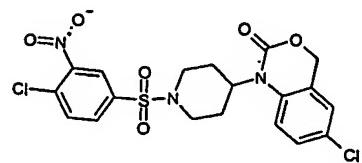
1-[1-(5-Dimethylamino-naphthalene-1-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



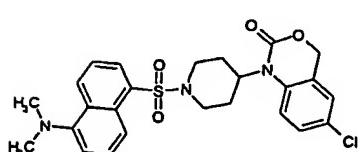
1-[1-(4-Chloro-3-nitrobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-8-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



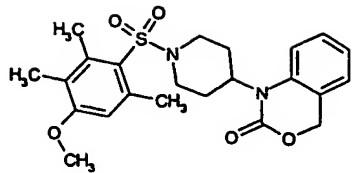
1-[1-(4-Chloro-3-nitrobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



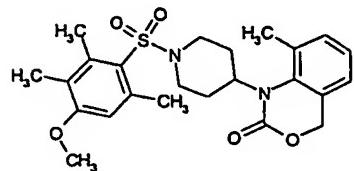
6-Chloro-1-[1-(4-chloro-3-nitrobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



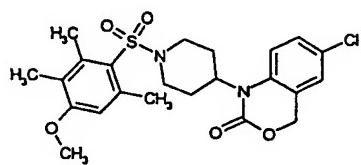
6-Chloro-1-[1-(5-dimethylamino-naphthalene-1-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



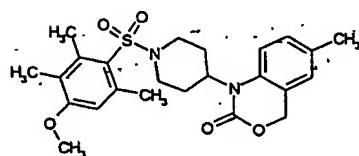
1-[1-(4-Methoxy-2,3,6-trimethylbenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



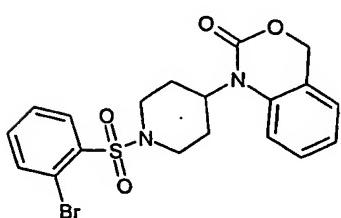
1-[1-(4-Methoxy-2,3,6-trimethylbenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-8-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



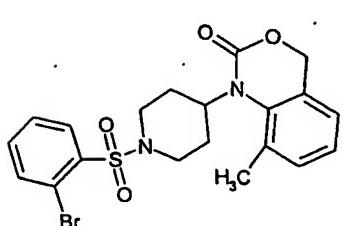
6-Chloro-1-[1-(4-methoxy-2,3,6-trimethylbenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



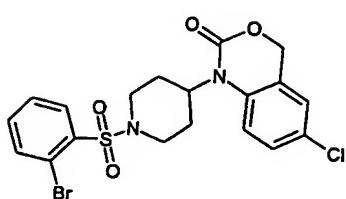
1-[1-(4-Methoxy-2,3,6-trimethylbenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



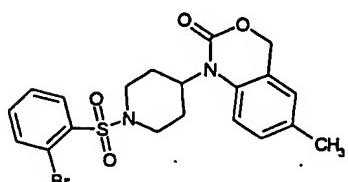
1-[1-(2-Bromo-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



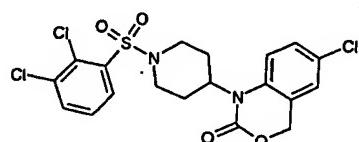
1-[1-(2-Bromo-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-8-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



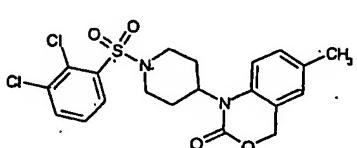
1-[1-(2-Bromo-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-chloro-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



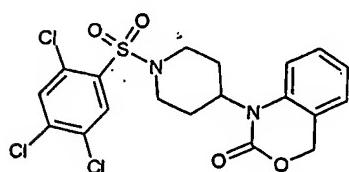
1-[1-(2-Bromo-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



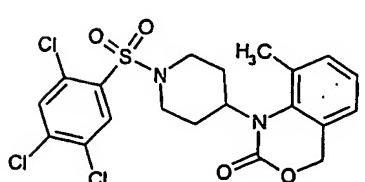
6-Chloro-1-[1-(2,3-dichlorobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



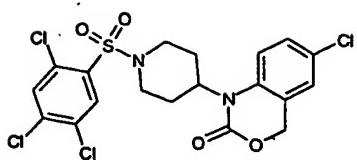
1-[1-(2,3-Dichlorobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



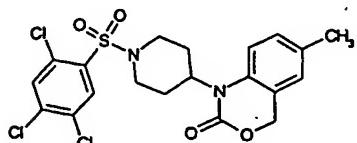
1-[1-(2,4,5-Trichlorobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



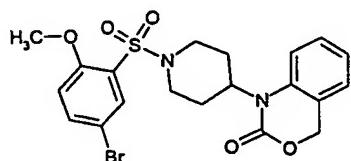
8-Methyl-1-[1-(2,4,5-trichlorobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



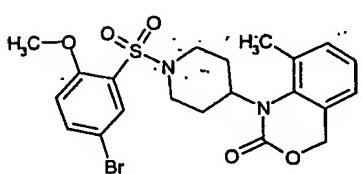
6-Chloro-1-[1-(2,4,5-trichlorobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



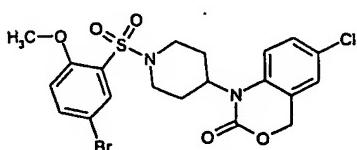
6-Methyl-1-[1-(2,4,5-trichlorobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



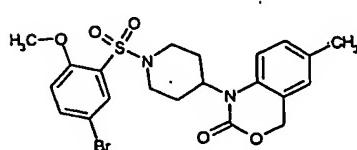
1-[1-(5-Bromo-2-methoxybenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



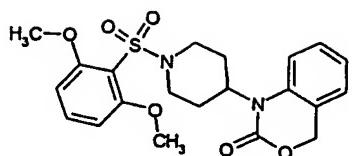
1-[1-(5-Bromo-2-methoxybenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-8-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



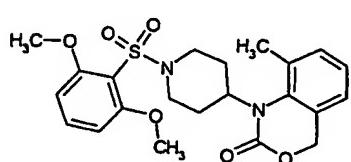
1-[1-(5-Bromo-2-methoxybenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-chloro-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



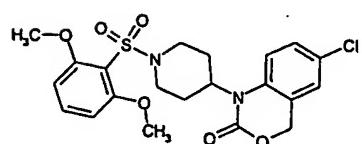
1-[1-(5-Bromo-2-methoxybenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



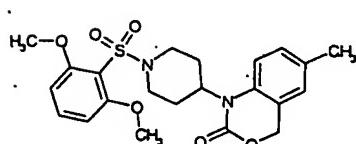
1-[1-(2,6-Dimethoxy-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



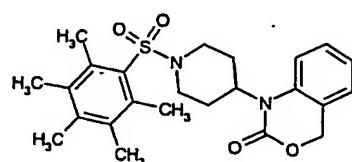
1-[1-(2,6-Dimethoxy-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-8-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



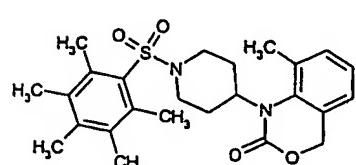
6-Chloro-1-[1-(2,6-dimethoxybenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



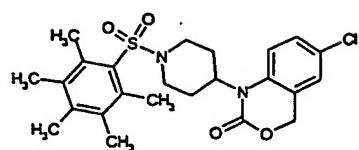
1-[1-(2,6-Dimethoxy-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



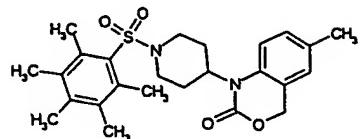
1-(1-Pentamethylbenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



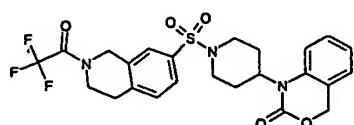
8-Methyl-1-(1-pentamethylbenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



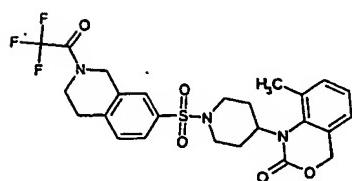
6-Chloro-1-(1-pentamethylbenzenesulfonyl-piperidin-4-yl)-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



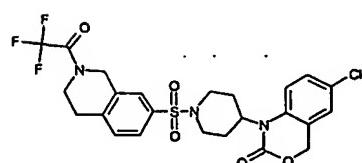
6-Methyl-1-(1-pentamethylbenzenesulfonyl-piperidin-4-yl)-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



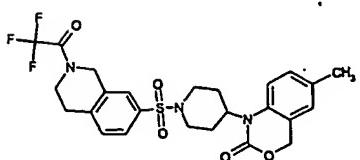
1-{1-[2-(2,2,2-Trifluoro-acetyl)-1,2,3,4-tetrahydro-isouquinoline-7-sulfonyl]-piperidin-4-yl}-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



8-Methyl-1-{1-[2-(2,2,2-trifluoro-acetyl)-1,2,3,4-tetrahydro-isouquinoline-7-sulfonyl]-piperidin-4-yl}-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one

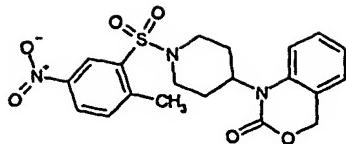


6-Chloro-1-{1-[2-(2,2,2-trifluoro-acetyl)-1,2,3,4-tetrahydro-isouquinoline-7-sulfonyl]-piperidin-4-yl}-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



6-Methyl-1-{1-[2-(2,2,2-trifluoro-acetyl)-1,2,3,4-tetrahydro-isouquinoline-7-sulfonyl]-piperidin-4-yl}-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one

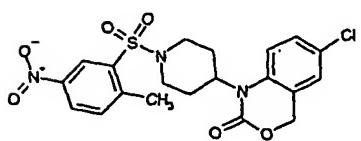
1-[1-(2-Methyl-5-nitrobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



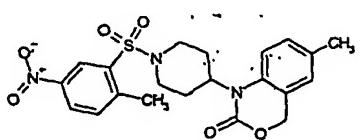
8-Methyl-1-[1-(2-methyl-5-nitrobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



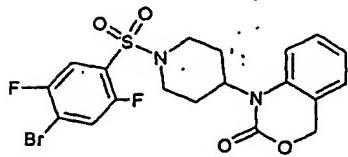
6-Chloro-1-[1-(2-methyl-5-nitrobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



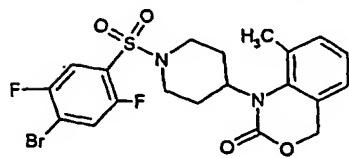
6-Methyl-1-[1-(2-methyl-5-nitrobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one

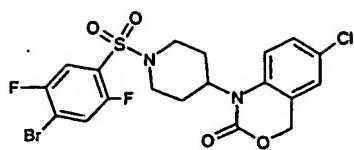


1-[1-(4-Bromo-2,5-difluorobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one

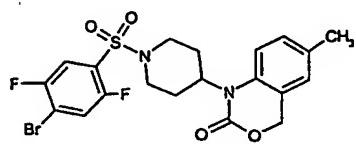


1-[1-(4-Bromo-2,5-difluorobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-8-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one

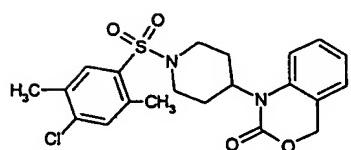




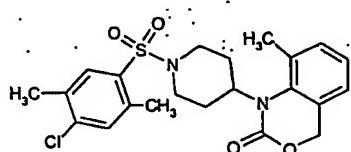
1-[1-(4-Bromo-2,5-difluorobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-chloro-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



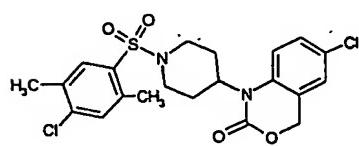
1-[1-(4-Bromo-2,5-difluorobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



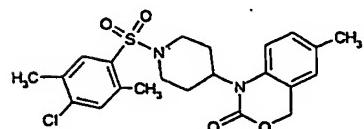
1-[1-(4-Chloro-2,5-dimethylbenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



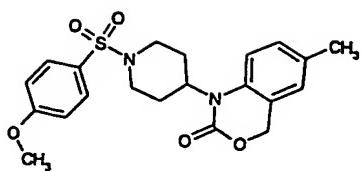
1-[1-(4-Chloro-2,5-dimethylbenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-8-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



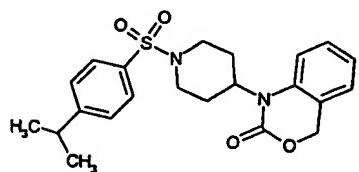
6-Chloro-1-[1-(4-chloro-2,5-dimethylbenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



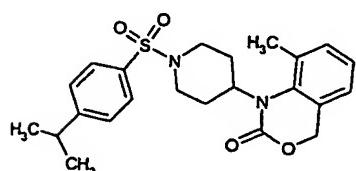
1-[1-(4-Chloro-2,5-dimethylbenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



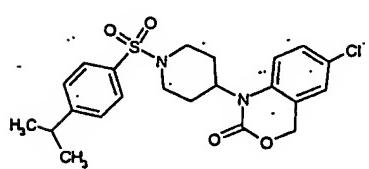
1-[1-(4-Methoxy-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



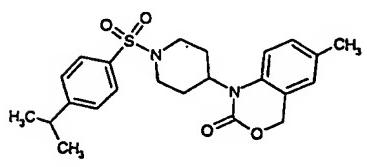
1-[1-(4-Isopropyl-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



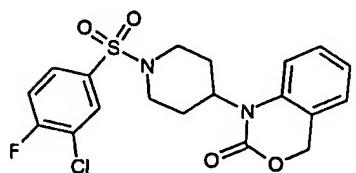
1-[1-(4-Isopropyl-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-8-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



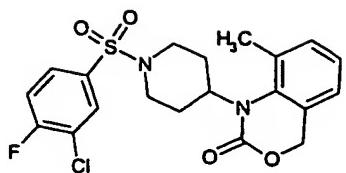
6-Chloro-1-[1-(4-isopropyl-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



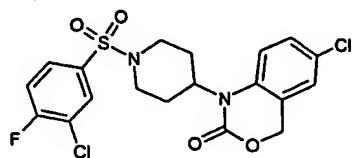
1-[1-(4-Isopropyl-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



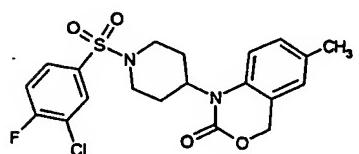
1-[1-(3-Chloro-4-fluoro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



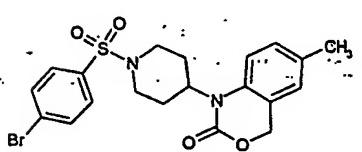
1-[1-(3-Chloro-4-fluoro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-8-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



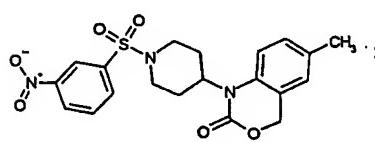
6-Chloro-1-[1-(3-chloro-4-fluoro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



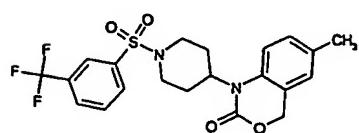
1-[1-(3-Chloro-4-fluoro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



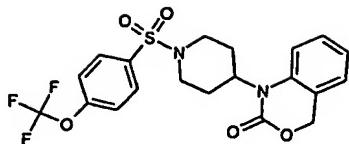
1-[1-(4-Bromo-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



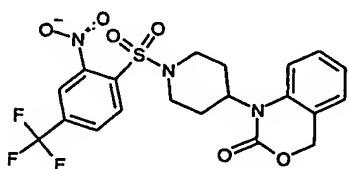
6-Methyl-1-[1-(3-nitro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



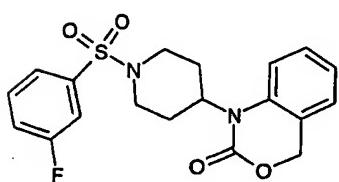
6-Methyl-1-[1-(3-trifluoromethyl-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



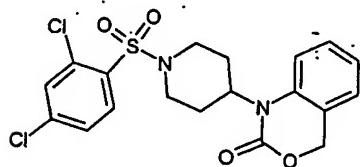
1-[1-(4-Trifluoromethoxybenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



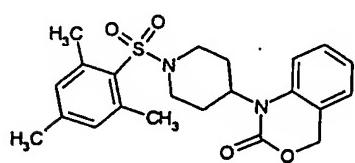
1-[1-(2-Nitro-4-trifluoromethylbenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



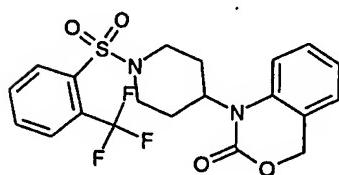
1-[1-(3-Fluoro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



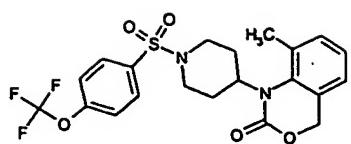
1-[1-(2,4-Dichloro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



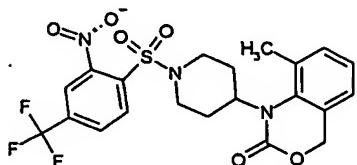
1-[1-(2,4,6-Trimethyl-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



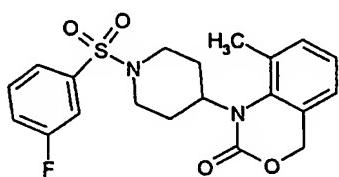
1-[1-(2-Trifluoromethylbenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



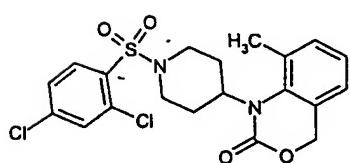
8-Methyl-1-[1-(4-trifluoromethoxybenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



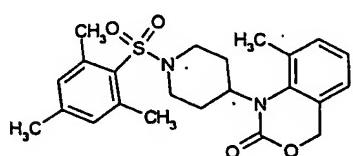
8-Methyl-1-[1-(2-nitro-4-trifluoromethylbenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



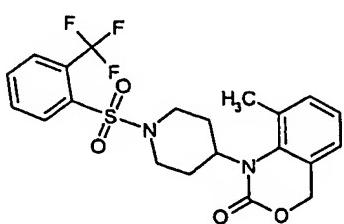
1-[1-(3-Fluoro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-8-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



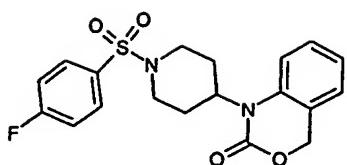
1-[1-(2,4-Dichloro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-8-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



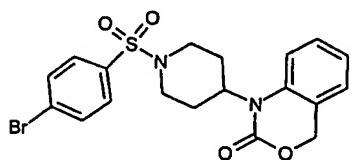
8-Methyl-1-[1-(2,4,6-trimethylbenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



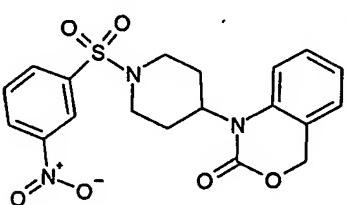
8-Methyl-1-[1-(2-trifluoromethylbenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



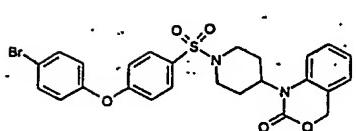
1-[1-(4-Fluoro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



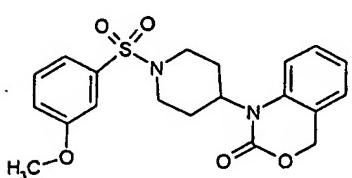
1-[1-(4-Bromo-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



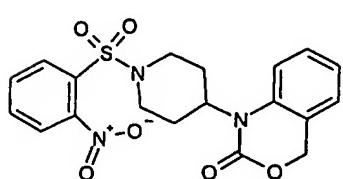
1-[1-(3-Nitro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



1-[1-[4-(4-Bromo-phenoxy)-benzenesulfonyl]-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one

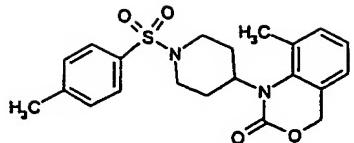


1-[1-(3-Methoxy-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one

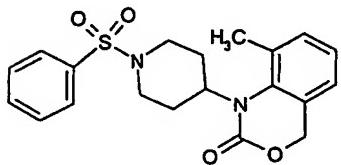


1-[1-(2-Nitro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one

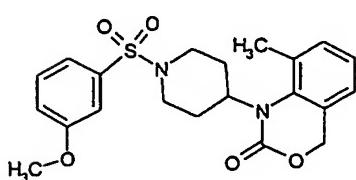
8-Methyl-1-[1-(toluene-4-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



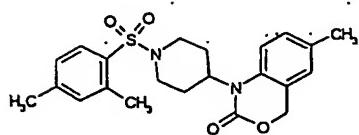
1-(1-Benzenesulfonyl-piperidin-4-yl)-8-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



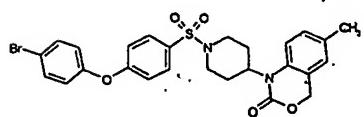
1-[1-(3-Methoxy-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-8-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



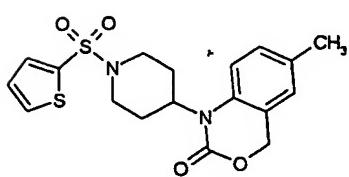
1-[1-(2,4-Dimethyl-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one

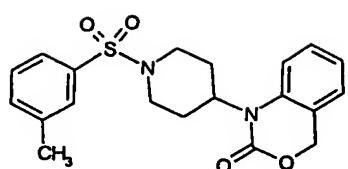


1-[1-[4-(4-Bromo-phenoxy)-benzenesulfonyl]-piperidin-4-yl]-6-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one

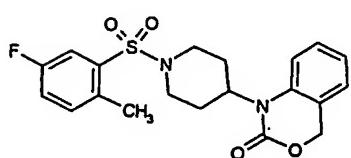


6-Methyl-1-[1-(thiophene-2-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one

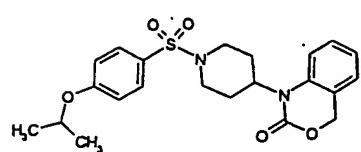




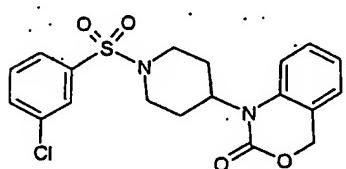
1-[1-(Toluene-3-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



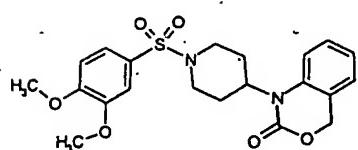
1-[1-(5-Fluoro-2-methylbenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



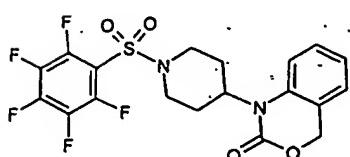
1-[1-(4-Isopropoxy-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



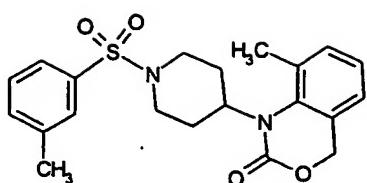
1-[1-(3-Chlorobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



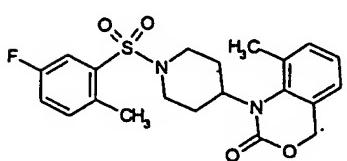
1-[1-(3,4-Dimethoxy-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



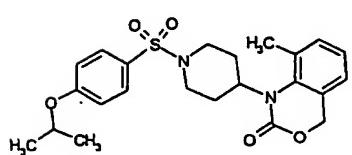
1-(1-Pentafluorobenzenesulfonyl)-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



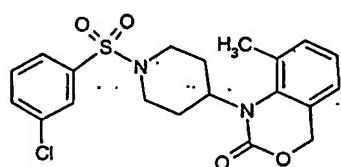
8-Methyl-1-[1-(toluene-3-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



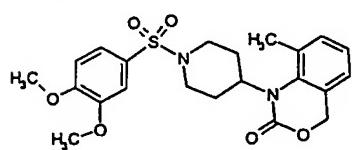
1-[1-(5-Fluoro-2-methylbenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-8-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



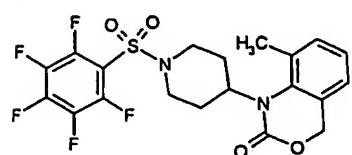
1-[1-(4-Isopropoxy-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-8-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



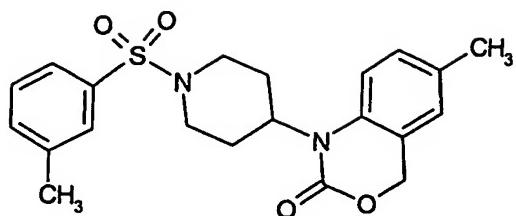
1-[1-(3-Chlorobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-8-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



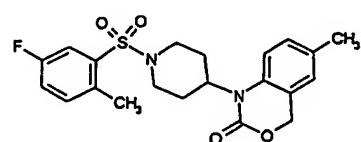
1-[1-(3,4-Dimethoxy-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-8-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



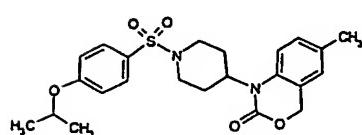
8-Methyl-1-(1-pentafluorobenzenesulfonyl-piperidin-4-yl)-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



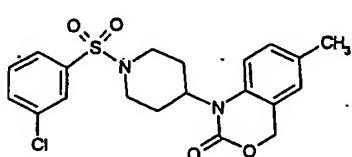
6-Methyl-1-[1-(toluene-3-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



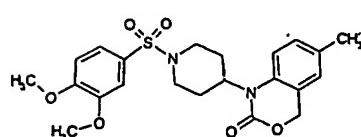
1-[1-(5-Fluoro-2-methylbenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



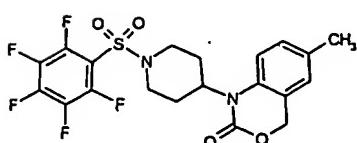
1-[1-(4-Isopropoxy-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



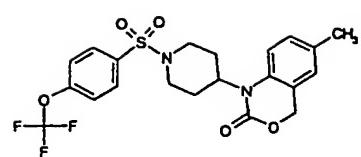
1-[1-(3-Chlorobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



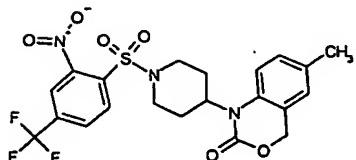
1-[1-(3,4-Dimethoxy-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



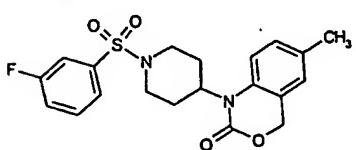
6-Methyl-1-(1-pentafluorobenzenesulfonyl-piperidin-4-yl)-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



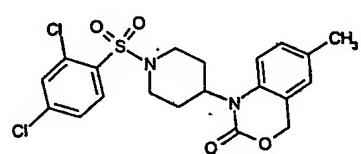
6-Methyl-1-[1-(4-trifluoromethoxybenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



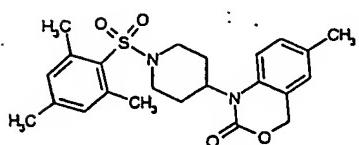
6-Methyl-1-[1-(2-nitro-4-trifluoromethylbenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



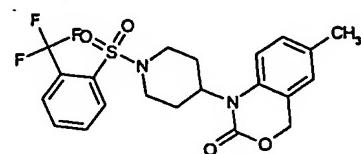
1-[1-(3-Fluoro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



1-[1-(2,4-Dichloro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one

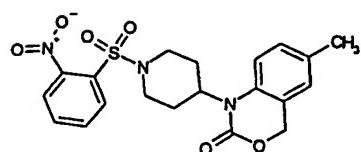
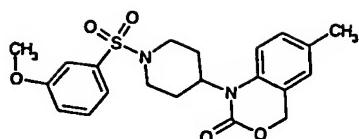


6-Methyl-1-[1-(2,4,6-trimethylbenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one

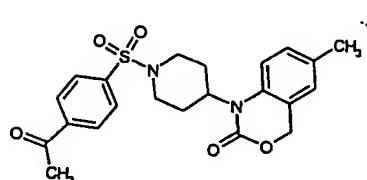


6-Methyl-1-[1-(2-trifluoromethylbenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one

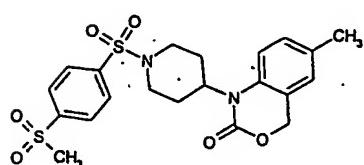
1-[1-(3-Methoxy-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



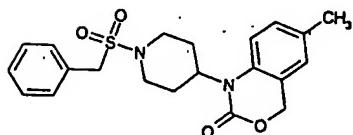
6-Methyl-1-[1-(2-nitrobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



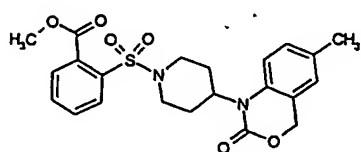
1-[1-(4-Acetyl-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



1-[1-(4-Methanesulfonyl-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one

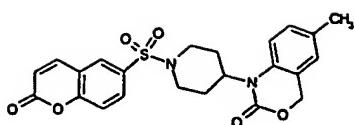


6-Methyl-1-(1-phenylmethanesulfonyl)-piperidin-4-yl)-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one

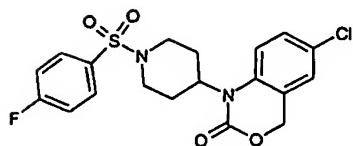


2-[4-(6-Methyl-2-oxo-4H-benzo[d][1,3]oxazin-1-yl)-piperidine-1-sulfonyl]-benzoic acid methyl ester

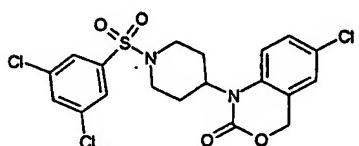
6-Methyl-1-[1-(2-oxo-2H-chromene-6-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



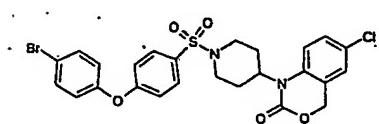
6-Chloro-1-[1-(4-fluoro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



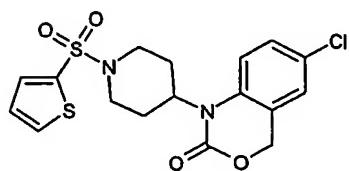
6-Chloro-1-[1-(3,5-dichloro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



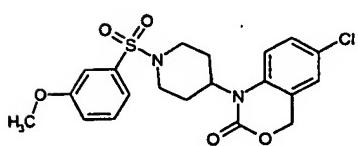
1-{1-[4-(4-Bromo-phenoxy)-benzenesulfonyl]-piperidin-4-yl}-6-chloro-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one

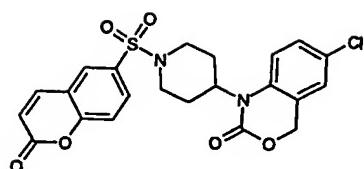


6-Chloro-1-[1-(thiophene-2-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one

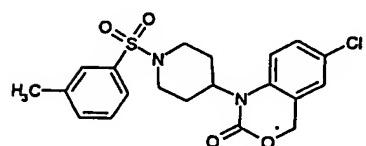


6-Chloro-1-[1-(3-methoxy-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one

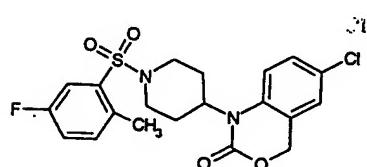




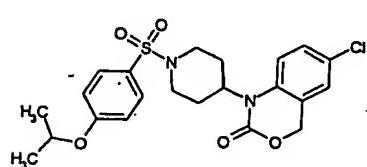
6-Chloro-1-[1-(2-oxo-2H-chromene-6-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



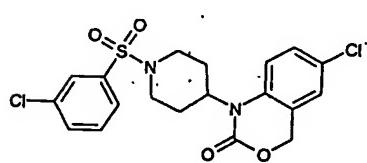
6-Chloro-1-[1-(toluene-3-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



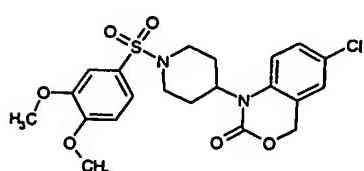
6-Chloro-1-[1-(5-fluoro-2-methylbenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



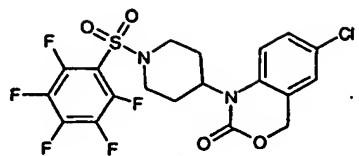
6-Chloro-1-[1-(4-isopropoxybenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



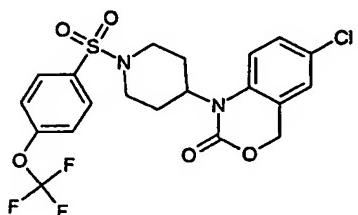
6-Chloro-1-[1-(3-chlorobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



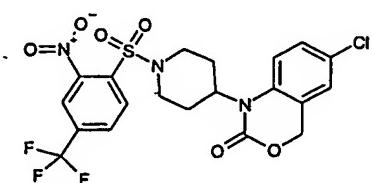
6-Chloro-1-[1-(3,4-dimethoxybenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



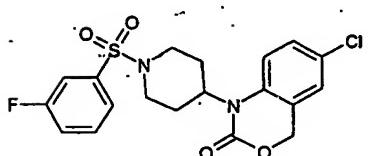
6-Chloro-1-(1-(4-fluorobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl)-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



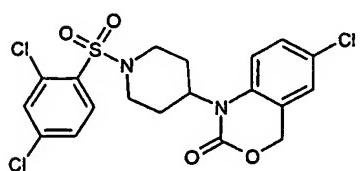
6-Chloro-1-[1-(4-trifluoromethoxybenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



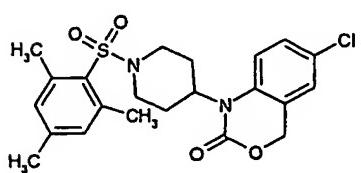
6-Chloro-1-[1-(2-nitro-4-trifluoromethylbenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



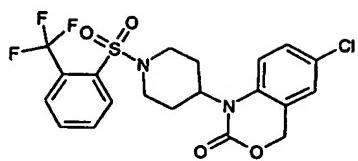
6-Chloro-1-[1-(3-fluorobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



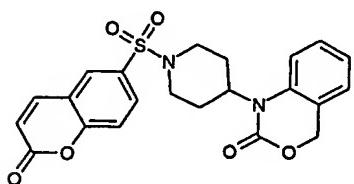
6-Chloro-1-[1-(2,4-dichlorobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



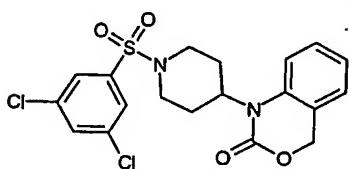
6-Chloro-1-[1-(2,4,6-trimethylbenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



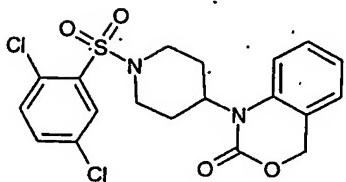
6-Chloro-1-[1-(2-trifluoromethylbenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



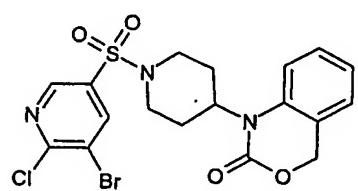
1-[1-(2-Oxo-2H-chromene-6-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



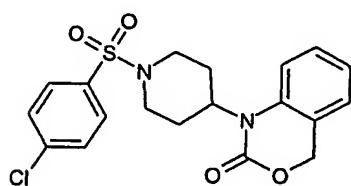
1-[1-(3,5-Dichlorobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



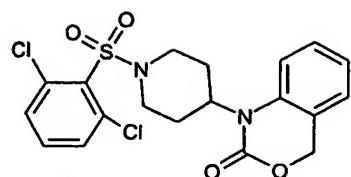
1-[1-(2,5-Dichlorobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



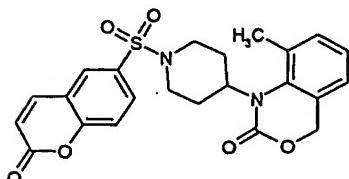
1-[1-(5-Bromo-6-chloro-pyridine-3-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



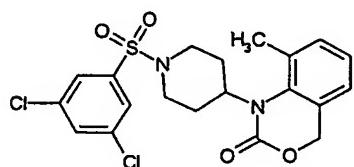
1-[1-(4-Chlorobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



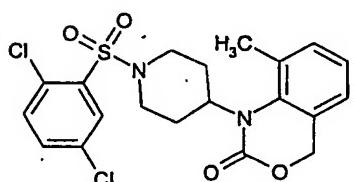
1-[1-(2,6-Dichloro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



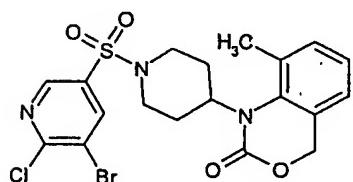
8-Methyl-1-[1-(2-oxo-2H-chromene-6-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



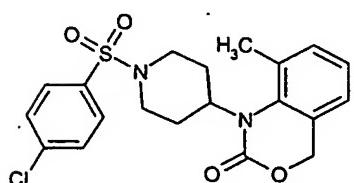
1-[1-(3,5-Dichloro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-8-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



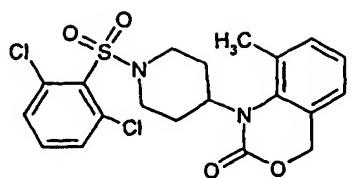
1-[1-(2,5-Dichloro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-8-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



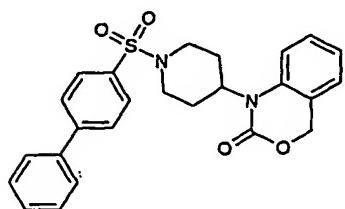
1-[1-(5-Bromo-6-chloro-pyridine-3-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-8-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



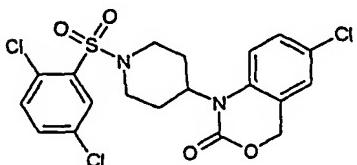
1-[1-(4-Chloro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-8-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



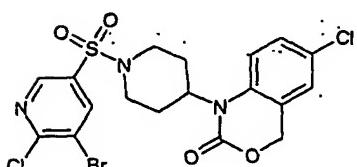
1-[1-(2,6-Dichloro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-8-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



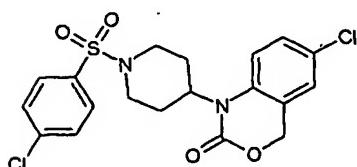
1-[1-(Biphenyl-4-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



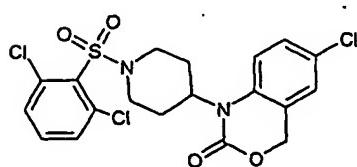
6-Chloro-1-[1-(2,5-dichloro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



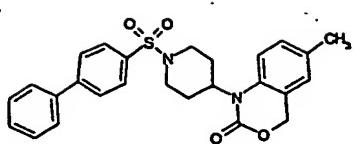
1-[1-(5-Bromo-6-chloro-pyridine-3-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-chloro-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



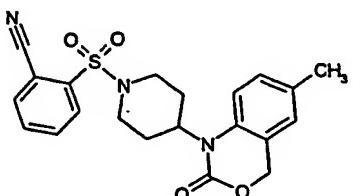
6-Chloro-1-[1-(4-chloro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



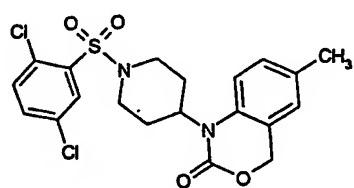
6-Chloro-1-[1-(2,6-dichloro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



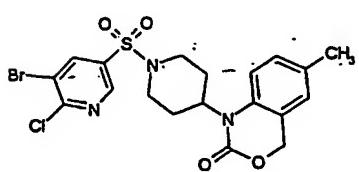
1-[1-(Biphenyl-4-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-methyl-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



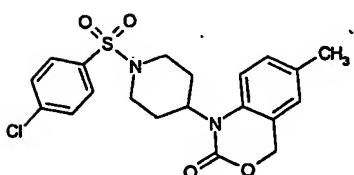
2-[4-(6-Methyl-2-oxo-4H-benzo[d][1,3]oxazin-1-yl)-piperidine-1-sulfonyl]-benzonitrile



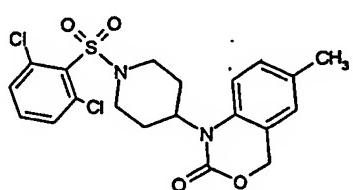
1-[1-(2,5-Dichloro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-methyl-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



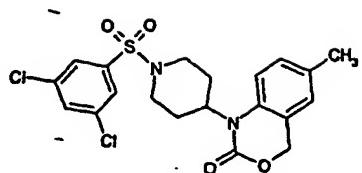
1-[1-(5-Bromo-6-chloro-pyridine-3-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-methyl-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



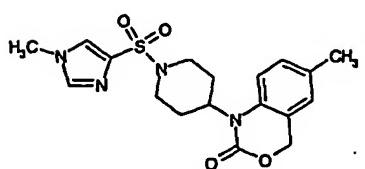
1-[1-(4-Chloro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-methyl-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



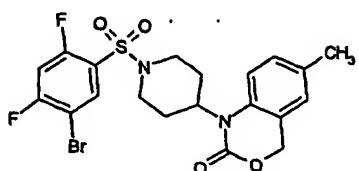
1-[1-(2,6-Dichloro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-methyl-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



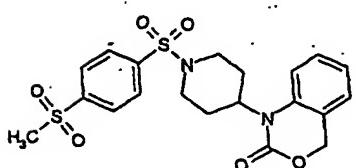
1-[1-(3,5-Dichloro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



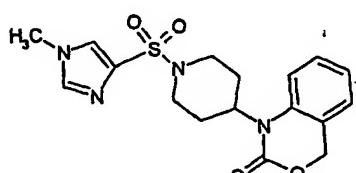
6-Methyl-1-[1-(1-methyl-1H-imidazole-4-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



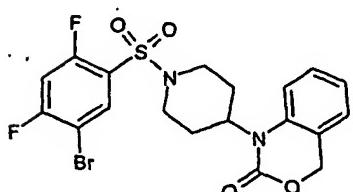
1-[1-(5-Bromo-2,4-difluoro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



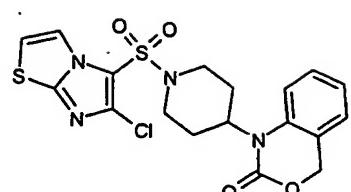
1-[1-(4-Methanesulfonyl-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



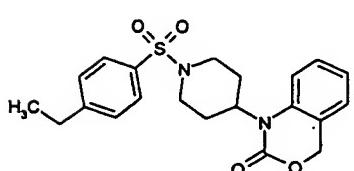
1-[1-(1-Methyl-1H-imidazole-4-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



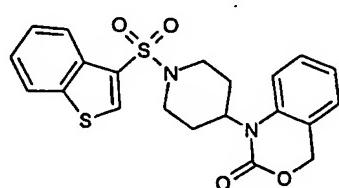
1-[1-(5-Bromo-2,4-difluoro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



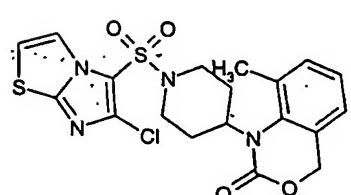
1-[1-(6-Chloro-imidazo[2,1-b]thiazole-5-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



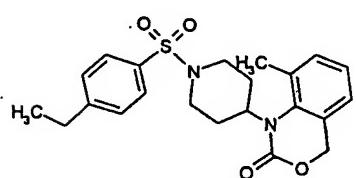
1-[1-(4-Ethyl-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



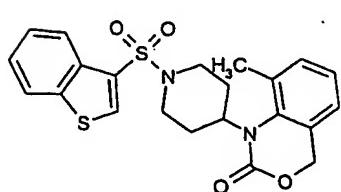
1-[1-(Benzo[b]thiophene-3-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



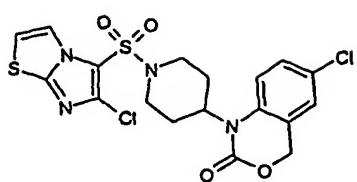
1-[1-(6-Chloro-imidazo[2,1-b]thiazole-5-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-8-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



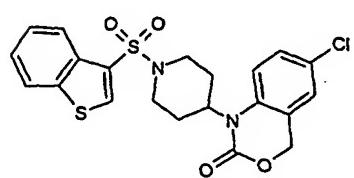
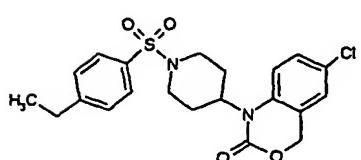
1-[1-(4-Ethyl-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-8-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



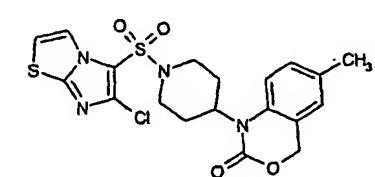
1-[1-(Benzo[b]thiophene-3-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-8-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



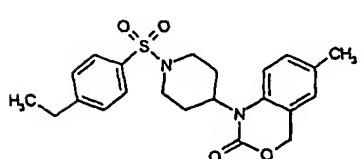
6-Chloro-1-[1-(6-chloro-imidazo[2,1-b]thiazole-5-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



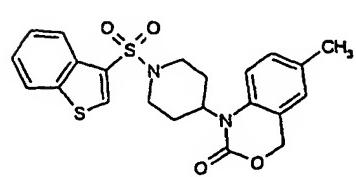
1-[1-(Benzo[b]thiophene-3-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-chloro-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



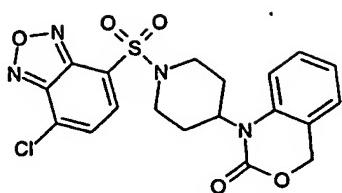
1-[1-(6-Chloro-imidazo[2,1-b]thiazole-5-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



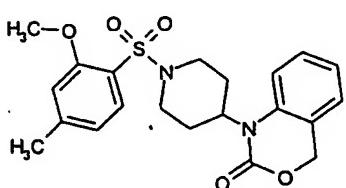
1-[1-(4-Ethyl-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



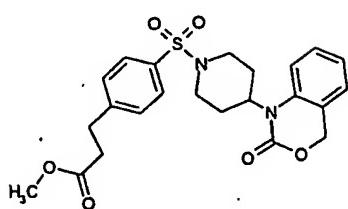
1-[1-(Benzo[b]thiophene-3-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



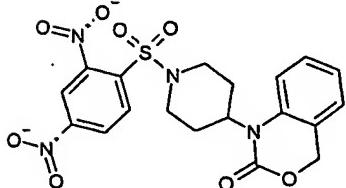
1-[1-(7-Chloro-benzo[1,2,5]oxadiazole-4-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



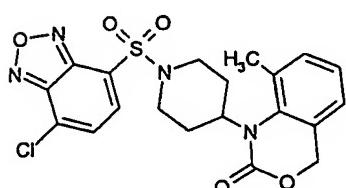
1-[1-(2-Methoxy-4-methylbenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



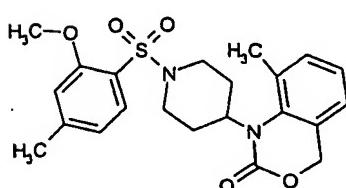
3-{4-[4-(2-Oxo-4H-benzo[d][1,3]oxazin-1-yl)-piperidine-1-sulfonyl]-phenyl}-propionic acid methyl ester



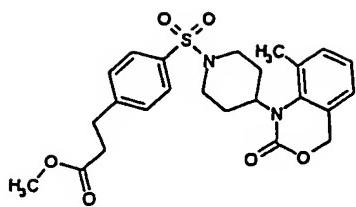
1-[1-(2,4-Dinitro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



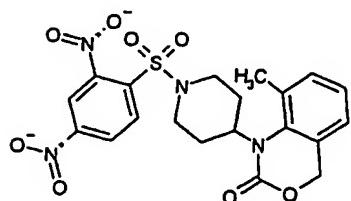
1-[1-(7-Chloro-benzo[1,2,5]oxadiazole-4-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-8-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



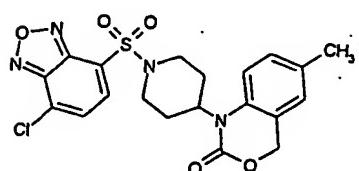
1-[1-(2-Methoxy-4-methylbenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-8-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



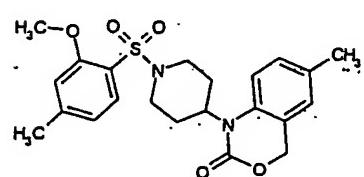
3-{4-[4-(8-Methyl-2-oxo-4H-benzo[d][1,3]oxazin-1-yl)-piperidine-1-sulfonyl]-phenyl}-propionic acid methyl ester



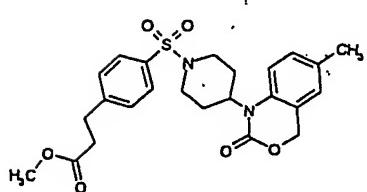
1-[1-(2,4-Dinitro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-8-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



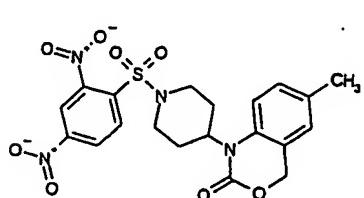
1-[1-(7-Chloro-benzo[1,2,5]oxadiazole-4-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



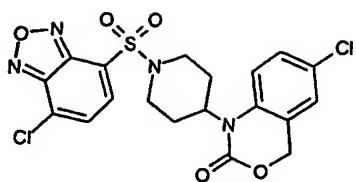
1-[1-(2-Methoxy-4-methyl-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



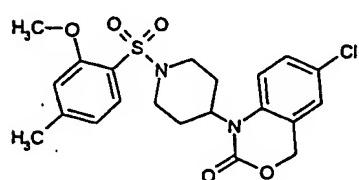
3-{4-[4-(6-Methyl-2-oxo-4H-benzo[d][1,3]oxazin-1-yl)-piperidine-1-sulfonyl]-phenyl}-propionic acid methyl ester



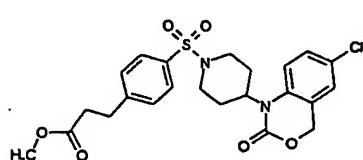
1-[1-(2,4-Dinitro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



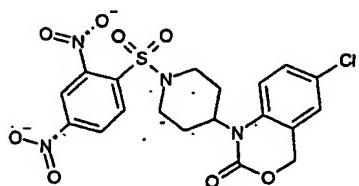
6-Chloro-1-[1-(7-chloro-benzo[1,2,5]oxadiazole-4-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



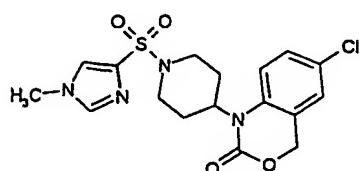
6-Chloro-1-[1-(2-methoxy-4-methylbenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



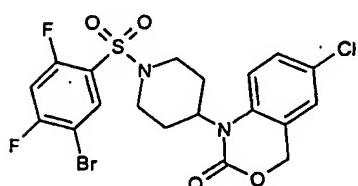
3-{4-[4-(6-Chloro-2-oxo-4H-benzo[d][1,3]oxazin-1-yl)-piperidine-1-sulfonyl]-phenyl}-propionic acid methyl ester



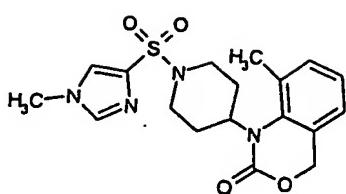
6-Chloro-1-[1-(2,4-dinitrobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



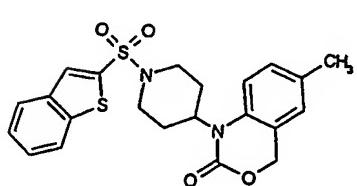
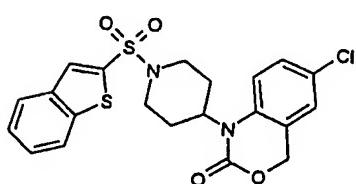
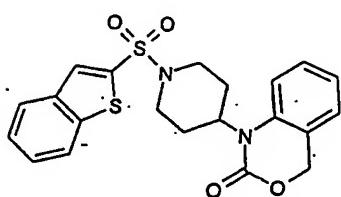
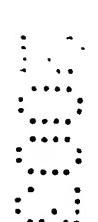
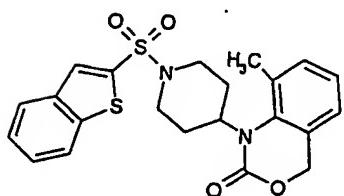
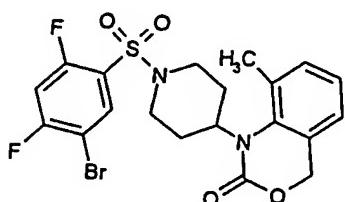
6-Chloro-1-[1-(1-methyl-1H-imidazole-4-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one

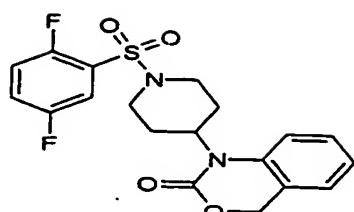


1-[1-(5-Bromo-2,4-difluorobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-chloro-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one

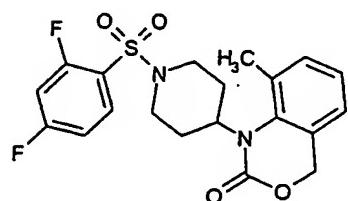


8-Methyl-1-[1-(1-methyl-1H-imidazol-4-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one

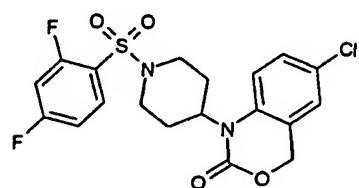




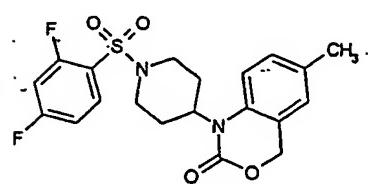
1-[1-(2,5-Difluorobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



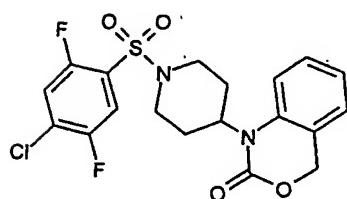
1-[1-(2,5-Difluorobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-8-methyl-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



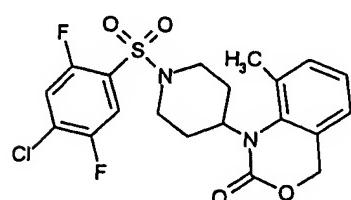
6-Chloro-1-[1-(2,5-difluorobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



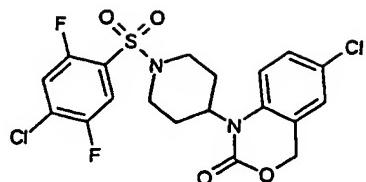
1-[1-(2,5-Difluorobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-methyl-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



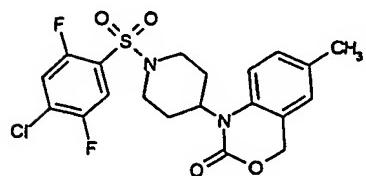
1-[1-(4-Chloro-2,5-difluorobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



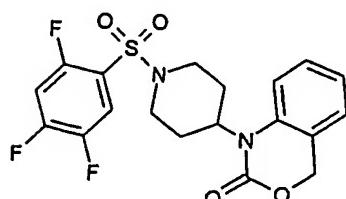
1-[1-(4-Chloro-2,5-difluorobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-8-methyl-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



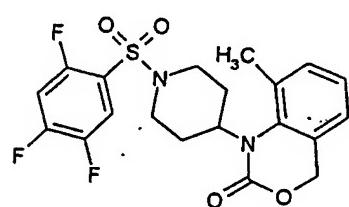
6-Chloro-1-[1-(4-chloro-2,5-difluoro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



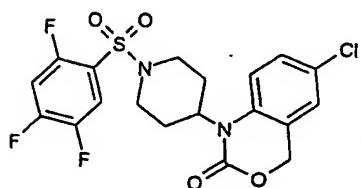
1-[1-(4-Chloro-2,5-difluoro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



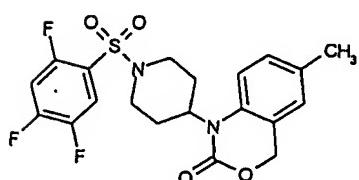
1-[1-(2,4,5-Trifluoro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



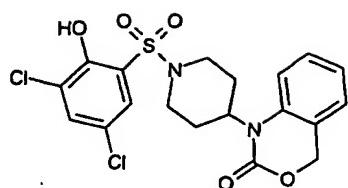
8-Methyl-1-[1-(2,4,5-trifluoro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



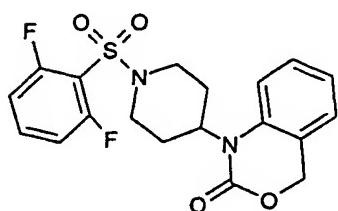
6-Chloro-1-[1-(2,4,5-trifluoro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



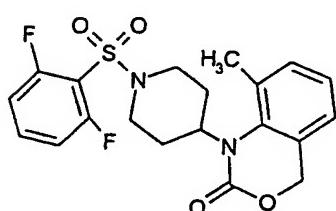
6-Methyl-1-[1-(2,4,5-trifluoro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



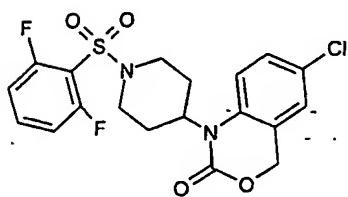
1-[1-(3,5-Dichloro-2-hydroxybenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



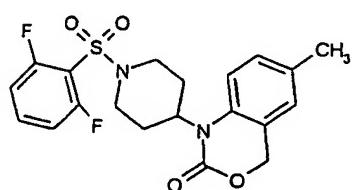
1-[1-(2,6-Difluorobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



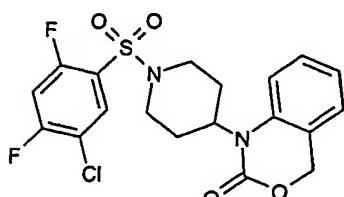
1-[1-(2,6-Difluorobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-8-methyl-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



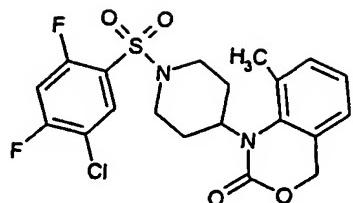
6-Chloro-1-[1-(2,6-difluorobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



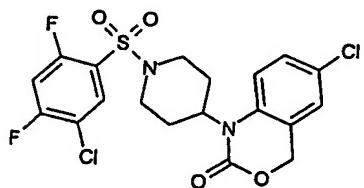
1-[1-(2,6-Difluorobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-methyl-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



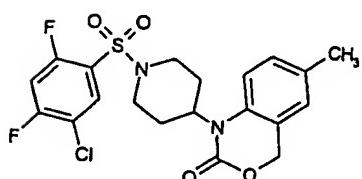
1-[1-(5-Chloro-2,4-difluorobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



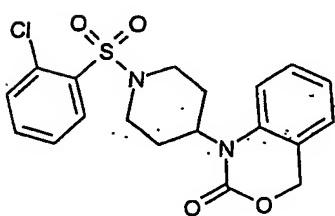
1-[1-(5-Chloro-2,4-difluoro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-8-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



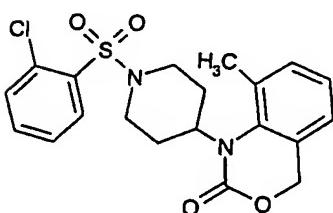
6-Chloro-1-[1-(5-chloro-2,4-difluoro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



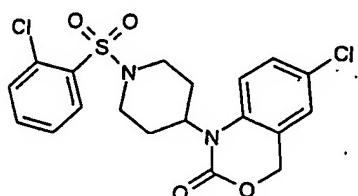
1-[1-(5-Chloro-2,4-difluoro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



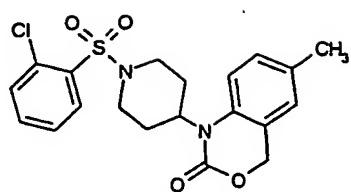
1-[1-(2-Chlorobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



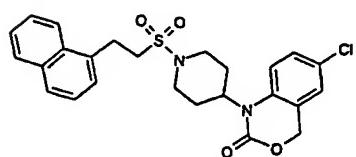
1-[1-(2-Chlorobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-8-methyl-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



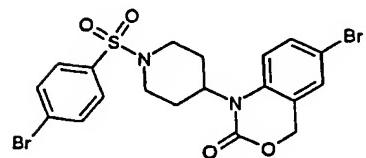
6-Chloro-1-[1-(2-chlorobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



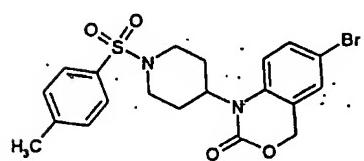
1-[1-(2-Chlorobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-methyl-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



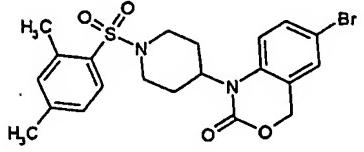
6-Chloro-1-[1-(2-naphthalen-1-yl-ethanesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



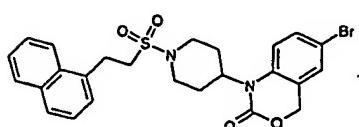
6-Bromo-1-[1-(4-bromobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



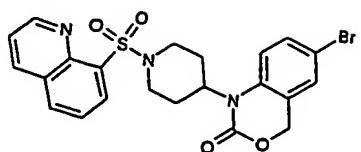
6-Bromo-1-[1-(toluene-4-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



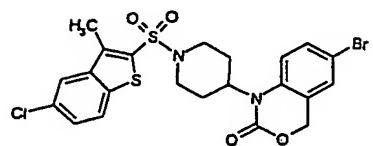
6-Bromo-1-[1-(2,4-dimethylbenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



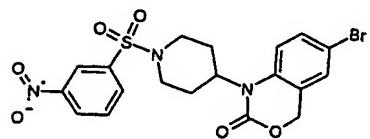
6-Bromo-1-[1-(2-naphthalen-1-yl-ethanesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



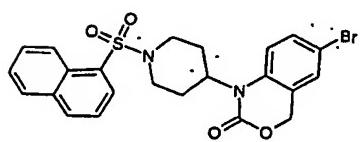
6-Bromo-1-[1-(quinoline-8-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



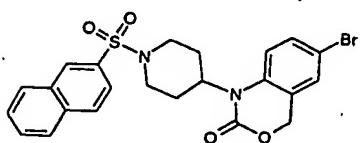
6-Bromo-1-[1-(5-chloro-3-methyl-benzo[b]thiophene-2-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



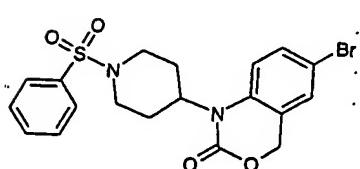
6-Bromo-1-[1-(3-nitrobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



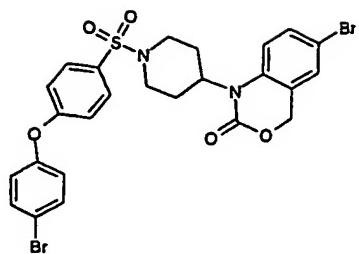
6-Bromo-1-[1-(naphthalene-1-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



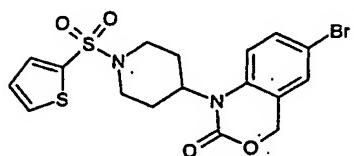
6-Bromo-1-[1-(naphthalene-2-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



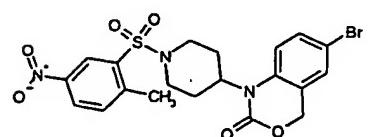
1-(1-Benzenesulfonyl-piperidin-4-yl)-6-bromo-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



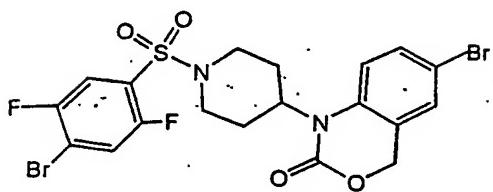
6-Bromo-1-{1-[4-(4-bromo-phenoxy)-benzenesulfonyl]-piperidin-4-yl}-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



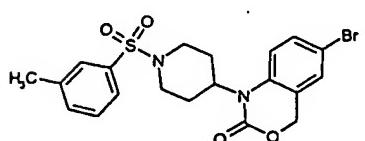
6-Bromo-1-[1-(thiophene-2-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



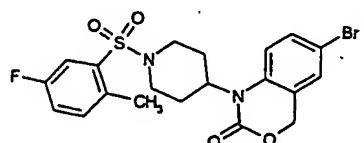
6-Bromo-1-[1-(2-methyl-5-nitro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



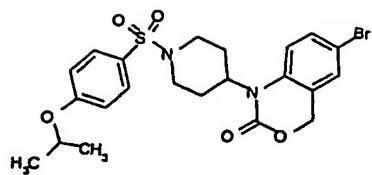
6-Bromo-1-[1-(4-bromo-2,5-difluoro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



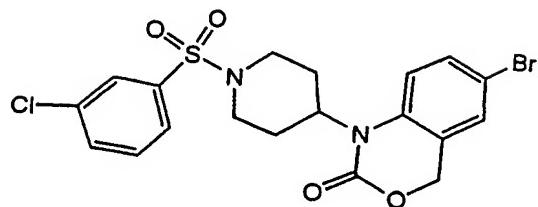
6-Bromo-1-[1-(toluene-3-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



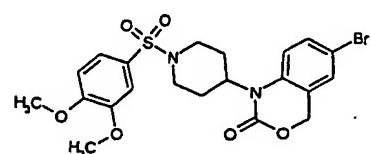
6-Bromo-1-[1-(5-fluoro-2-methyl-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



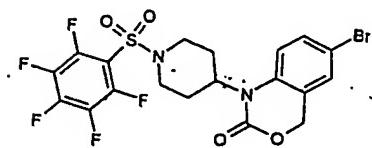
6-Bromo-1-[1-(4-isopropoxybenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



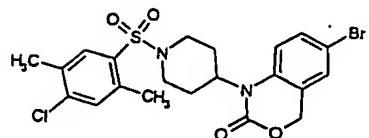
6-Bromo-1-[1-(3-chlorobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



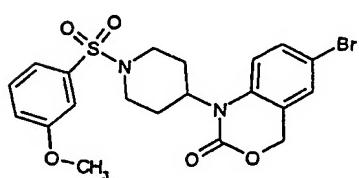
6-Bromo-1-[1-(3,4-dimethoxybenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



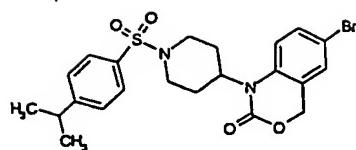
6-Bromo-1-(1-pentafluorobenzenesulfonyl-piperidin-4-yl)-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



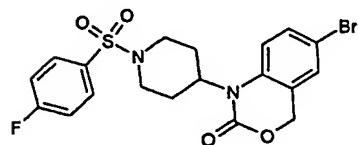
6-Bromo-1-[1-(4-chloro-2,5-dimethylbenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



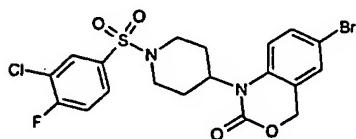
6-Bromo-1-[1-(3-methoxybenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



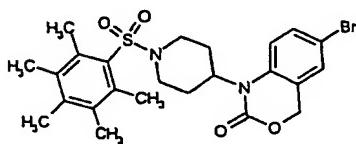
6-Bromo-1-[1-(4-isopropylbenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



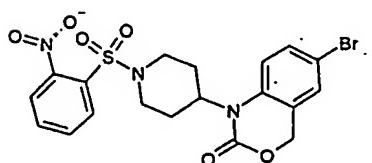
6-Bromo-1-[1-(4-fluorobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



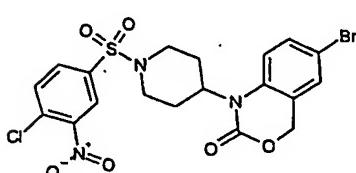
6-Bromo-1-[1-(3-chloro-4-fluorobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



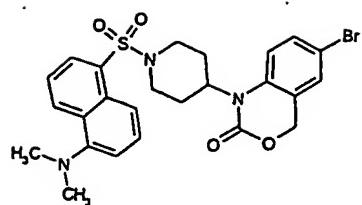
6-Bromo-1-(1-pentamethylbenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



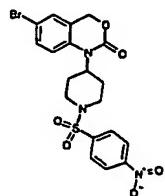
6-Bromo-1-[1-(2-nitrobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



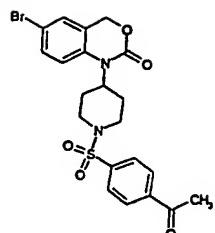
6-Bromo-1-[1-(4-chloro-3-nitrobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



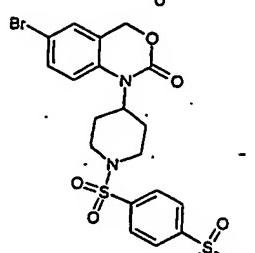
6-Bromo-1-[1-(5-dimethylamino-naphthalene-1-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



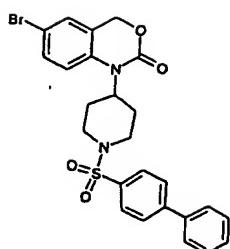
6-Bromo-1-[1-(4-nitrobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



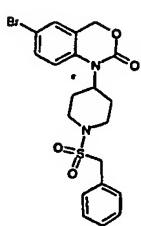
1-[1-(4-Acetylbenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-bromo-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



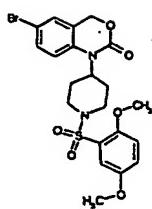
6-Bromo-1-[1-(4-methanesulfonylbenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



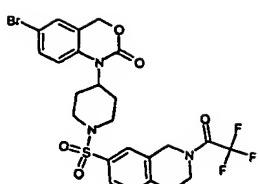
1-[1-(Biphenyl-4-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-6-bromo-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



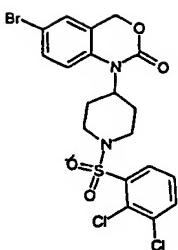
6-Bromo-1-(1-phenylmethanesulfonyl-piperidin-4-yl)-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



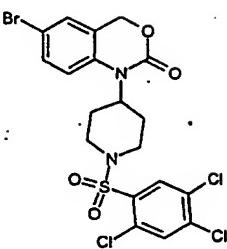
6-Bromo-1-[1-(2,5-dimethoxybenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



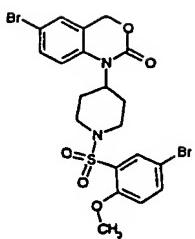
6-Bromo-1-{1-[2-(2,2,2-trifluoro-acetyl)-1,2,3,4-tetrahydro-isoquinoline-7-sulfonyl]-piperidin-4-yl}-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



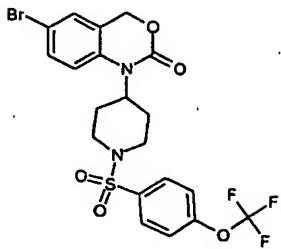
6-Bromo-1-[1-(2,3-dichlorobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



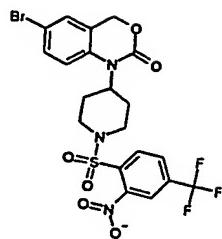
6-Bromo-1-[1-(2,4,5-trichlorobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



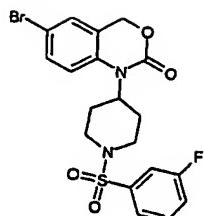
6-Bromo-1-[1-(5-bromo-2-methoxybenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



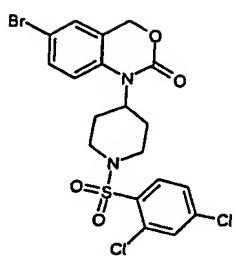
6-Bromo-1-[1-(4-trifluoromethoxybenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxazin-2-one



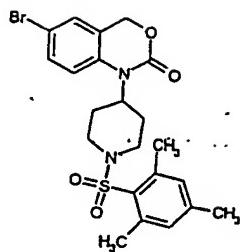
6-Bromo-1-[1-(2-nitro-4-trifluoromethylbenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



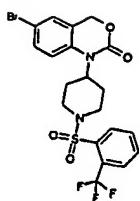
6-Bromo-1-[1-(3-fluorobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



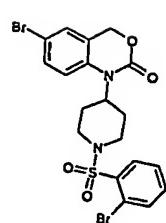
6-Bromo-1-[1-(2,4-dichlorobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



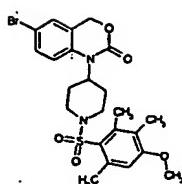
6-Bromo-1-[1-(2,4,6-trimethylbenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



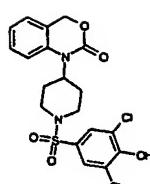
6-Bromo-1-[1-(2-trifluoromethylbenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



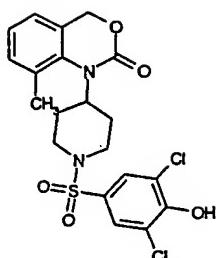
6-Bromo-1-[1-(2-bromobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



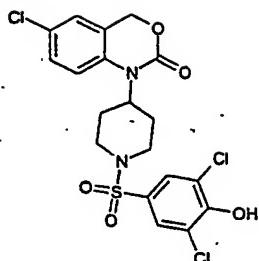
6-Bromo-1-[1-(4-methoxy-
2,3,6-trimethyl-
benzenesulfonyl)-piperidin-4-
yl]-1,4-dihydro-
benzo[d][1,3]oxazin-2-one



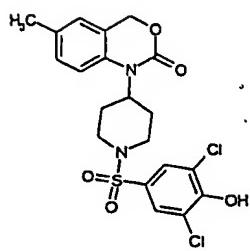
1-[1-(3,5-Dichloro-4-hydroxy-
benzenesulfonyl)-piperidin-4-
yl]-1,4-dihydro-
benzo[d][1,3]oxazin-2-one



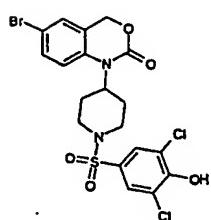
1-[1-(3,5-Dichloro-4-hydroxy-
benzenesulfonyl)-piperidin-4-
yl]-8-methyl-1,4-dihydro-
benzo[d][1,3]oxazin-2-one



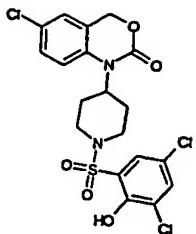
6-Chloro-1-[1-(3,5-dichloro-4-
hydroxybenzenesulfonyl)-
piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-
benzo[d][1,3]oxazin-2-one



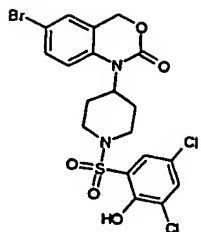
1-[1-(3,5-Dichloro-4-hydroxy-
benzenesulfonyl)-piperidin-4-
yl]-6-methyl-1,4-dihydro-
benzo[d][1,3]oxazin-2-one



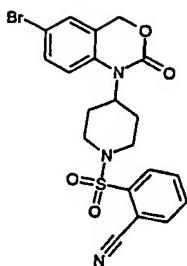
6-Bromo-1-[1-(3,5-dichloro-4-
hydroxybenzenesulfonyl)-
piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-
benzo[d][1,3]oxazin-2-one



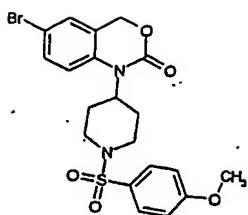
6-Chloro-1-[1-(3,5-dichloro-2-hydroxy-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



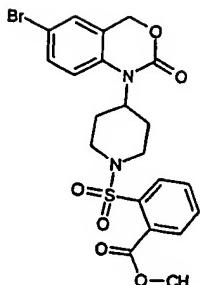
6-Bromo-1-[1-(3,5-dichloro-2-hydroxy-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



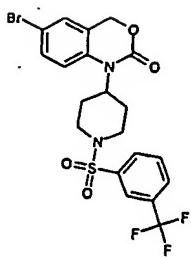
2-[4-(6-Bromo-2-oxo-4H-benzo[d][1,3]oxazin-1-yl)-piperidine-1-sulfonyl]-benzonitrile



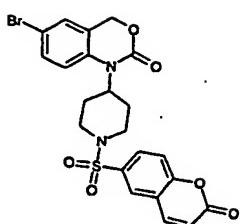
6-Bromo-1-[1-(4-methoxy-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



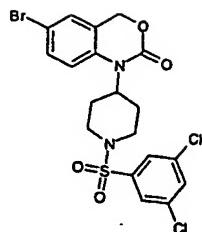
2-[4-(6-Bromo-2-oxo-4H-benzo[d][1,3]oxazin-1-yl)-piperidine-1-sulfonyl]-benzoic acid methyl ester



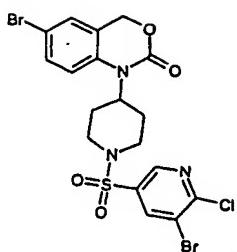
6-Bromo-1-[1-(2-oxo-2H-chromene-6-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



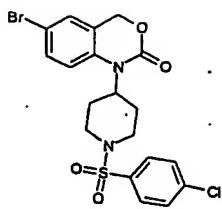
6-Bromo-1-[1-(3,5-dichlorobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



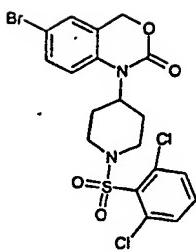
6-Bromo-1-[1-(2,5-dichlorobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



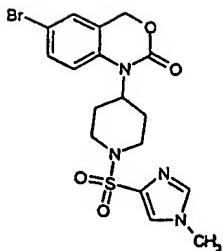
6-Bromo-1-[1-(5-bromo-6-chloro-pyridine-3-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



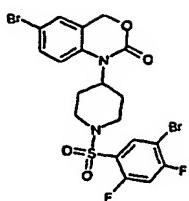
6-Bromo-1-[1-(4-chlorobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



6-Bromo-1-[1-(2,6-dichlorobenzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



6-Bromo-1-[1-(1-methyl-1H-imidazole-4-sulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydrobenzo[d][1,3]oxazin-2-one



6-Bromo-1-[1-(5-bromo-2,4-difluoro-benzenesulfonyl)-piperidin-4-yl]-1,4-dihydro-benzo[d][1,3]oxacin-2-one

Más particularmente preferidos son compuestos de fórmula general (I) seleccionados del grupo consistente en:

5

1-[1-(5-Cloro-3-metil-benzo[b]tiofenil-2-sulfonil)-piperidin-4-il]-1,4-dihidro-benzo[d][1,3]oxazin-2-ona,

10

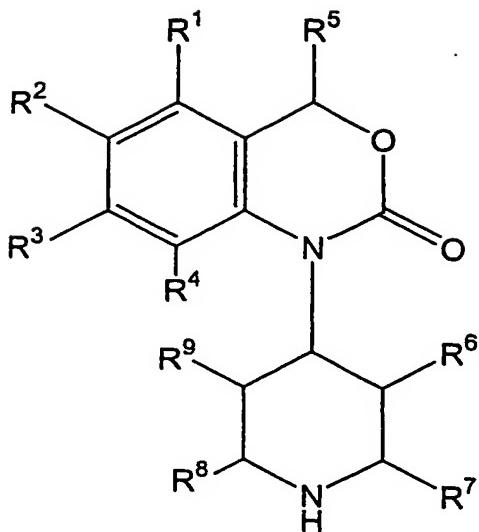
1-[1-(5-Dimetilamino-naftil-1-sulfonil)-piperidin-4-il]-8-metil-1,4-dihidro-benzo[d][1,3]oxazin-2-ona,

1-[1-(5-Dimetilamino-naftil-1-sulfonil)-piperidin-4-il]-1,4-dihidro-benzo[d][1,3]oxazin-2-ona;

15

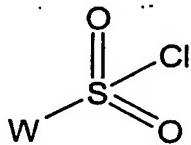
y sus sales correspondientes, y solvatos correspondientes.

En otro aspecto, la presente invención también aporta un proceso para la preparación de compuestos sulfonamídicos derivados de benzoxazinona de fórmula general (I), en los cuales R¹-R⁹ y W tienen la significación indicada anteriormente, que comprende la reacción de al menos un compuesto piperidínico de fórmula general (II) y/o una de sus sales correspondientes, preferiblemente un clorhidrato,



(II)

en la cual R¹ a R⁹ tienen la significación indicada anteriormente, con al menos
5 un compuesto de fórmula general (III),



(III)

10 en la cual W tiene la significación indicada anteriormente, en un medio de
reacción adecuado, opcionalmente en presencia de al menos una base y/o al
menos un agente auxiliar, para dar un compuesto de fórmula general (I).

15 Los medios de reacción adecuados son por ejemplo disolventes orgánicos,
entre los que se incluyen éteres, preferiblemente dietil éter, dioxano,
tetrahidrofurano, dimetil glicol éter, o alcoholes, por ejemplo metanol, etanol,
propanol, isopropanol, butanol, isobutanol, tert-butanol, o hidrocarburos
preferiblemente benceno, tolueno, xileno, hexano, ciclohexano, éter de

petróleo o hidrocarburos halogenados; por ejemplo diclorometano, triclorometano, tetraclorometano, dicloroetileno, tricloroetileno, clorobenceno o/y otros disolventes , preferiblemente acetato de etilo-, trietilamina; piridina, dimetilsulfóxido, dimetilformamida, hexametilfosforamida, acetonitrilo, acetona o nitrometano. También pueden utilizarse mezclas de los disolventes mencionados

Las bases que pueden utilizarse para el proceso, de acuerdo con la presente invención, son en general bases orgánicas o inorgánicas, preferiblemente hidróxidos de metales alcalinos, por ejemplo hidróxido sódico o hidróxido potásico, o de otros metales como el hidróxido de bario o diferentes carbonatos, preferiblemente carbonato potásico, carbonato sódico; carbonato de calcio, o hidrogenocarbonatos preferiblemente hidrogeno carbonato potásico, hidrogeno carbonato sódico o alcóxidos, por ejemplo metóxido sódico, metóxido potásico, etóxido sódico, o tert-butóxido potásico, o aminas orgánicas, preferiblemente trietilamina, diisopropiletilamina o heterociclos, por ejemplo 1,4-diazabiciclo[2.2.2]octano; 1,8-diazabiciclo[5.4.0]undec-7-eno, piridina, diamino piridina; dimetilaminopiridina, metilpiperidina o morfolina. También pueden utilizarse mezclas de las bases mencionadas.

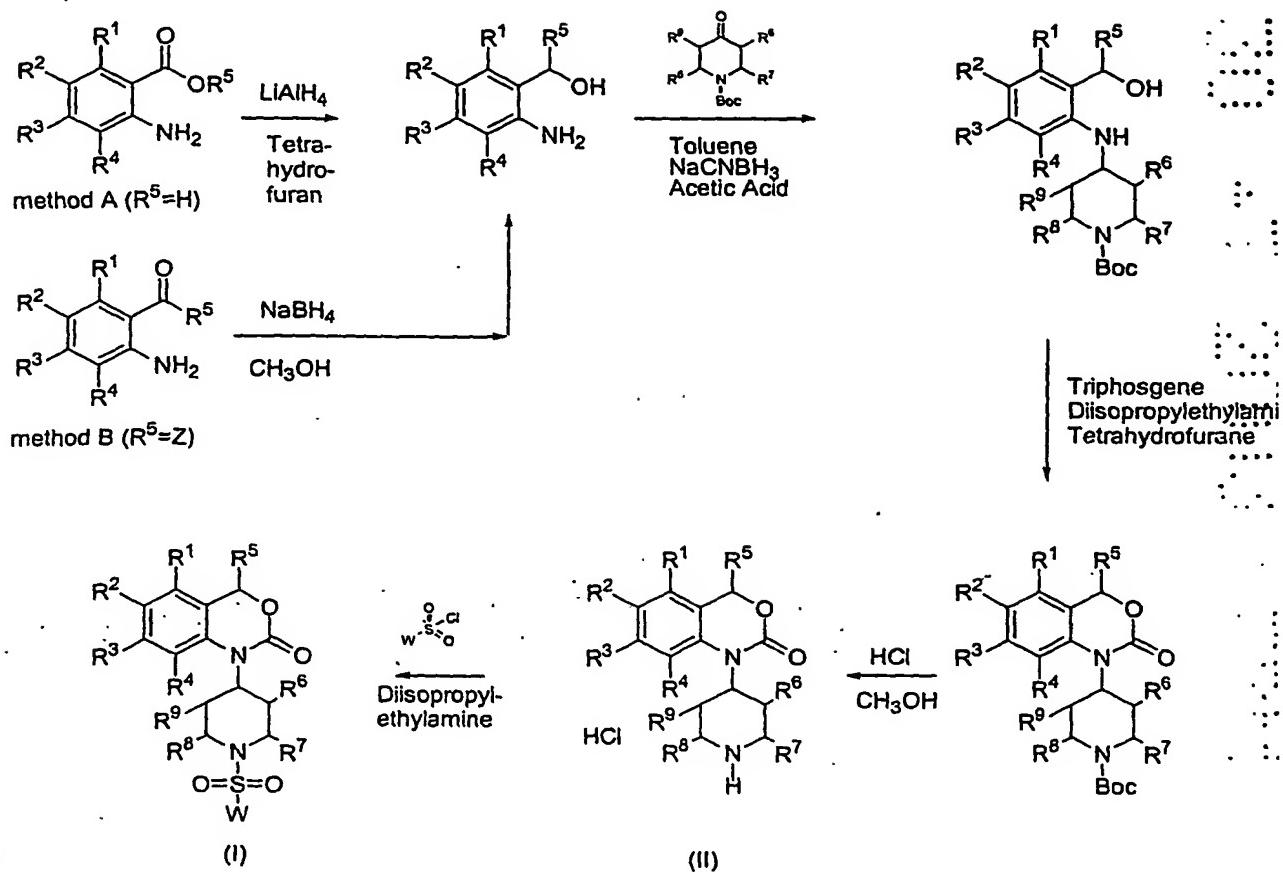
Durante las reacciones sintéticas descritas anteriormente o durante la preparación de los compuestos de fórmulas generales (II) o (III), puede ser necesario y/o deseable proteger los grupos sensibles o los reactivos. Esto puede realizarse utilizando grupos protectores convencionales como los descritos en la literatura [*Protective Groups in Organic Chemistry*, ed. J. F.W. McOmie, Plenum Press, 1973; T.W. Greene & P.G.M.Wuts, *Protective Groups in Organic Chemistry*, John Wiley & sons, 1991]. Esta descripción bibliográfica se incorpora aquí como referencia y forma parte la divulgación. Los grupos protectores también pueden eliminarse convenientemente con medios bien conocidos en el estado de la técnica.

Los compuestos de fórmulas generales (II) y (III) están disponibles comercialmente o pueden producirse con métodos conocidos en el estado de la técnica. La reacción de compuestos de fórmulas generales (II) y (III) para obtener compuestos sulfonamídicos derivados de benzoxazinona de fórmula general (I) también puede conseguirse con métodos convencionales en el estado de la técnica.

- 5 Las benzoxazinonas sustituidas de fórmula general (II) donde R⁵ representa H, han sido sintetizadas preferentemente a partir de los ácidos antranílicos sustituidos o sus esteres por reducción a los correspondientes alcoholes 10 benzílicos (ver Esquema 1, Método A). Por aminación reductora con la 1-Boc-4-piperidona , se introduce la Boc-piperidina. La formación del anillo de benzoxazinona se produce por ciclación con trifosgeno, un tratamiento en medio ácido permite la desprotección de la piperidina, según método descrito 15 P.D.Williams et al. , *J.Med.Chem.*, 1995, 38, 4634 y posteriormente I.M.Bell et al., *J.Med.Chem.*, 1998 ,41 ,2146 , que se incorporan aquí como referencias y forman parte de su divulgación. Estas benzoxazinonas sustituidas (II) nos permiten 20 obtener los compuestos de fórmula general (I) por reacción de un cloruro de ácido sulfónico sustituido de fórmula general (III).
- 20 Por reducción de las cetonas correspondientes via métodos convencionales conocidos en el estado de la técnica , por ejemplo por reducción con borohidruro sódico (ver esquema 1, método B, R⁵= Z) pueden obtenerse 25 compuestos sulfonamídicos derivados de benzoxazinona de fórmula general (I), donde R5 representa un radical alifático, lineal o ramificado, saturado o insaturado, opcionalmente al menos mono sustituido, opcionalmente puede contener como mínimo un heteroátomo formando parte de un anillo cicloalifático opcionalmente al menos mono sustituido (designado por Z en el método B).
- 30 Los respectivos reactivos usados en dicho proceso para la preparación de compuestos sulfonamídicos derivados de benzoxazinona de fórmula general (I)

están disponibles comercialmente o pueden obtenerse por métodos conocidos en estado de la técnica.

Esquema 1:



5

La presente invención proporciona igualmente un proceso para la preparación de sales de compuestos sulfonamídicos derivados de benzoxazinona de fórmula general (I), en el cual al menos un compuesto de fórmula general (I) que tenga al menos un grupo básico se hace reaccionar con un ácido orgánico y/o mineral, preferiblemente en presencia de un medio de reacción adecuado. Medios de reacción adecuados son, por ejemplo, los facilitados anteriormente. Ácidos minerales adecuados son por ejemplo los ácidos clorhídrico, bromhídrico, fosfórico, sulfúrico y nítrico; ácidos orgánicos adecuados son por ejemplo los ácidos cítrico, maleico, fumárico, tartárico o sus derivados, ácido *p*-toluensulfónico, ácido metansulfónico o ácido canforsulfánico.

10

- La presente invención proporciona igualmente un proceso para la preparación de sales de compuestos sulfonamídicos derivados de benzoxazinona de fórmula general (I), en el cual al menos un compuesto de fórmula general (I) que tenga al menos un grupo ácido se hace reaccionar con una o más bases adecuadas, preferiblemente en presencia de un medio de reacción adecuado. Bases adecuadas son por ejemplo hidróxidos, carbonatos, hidrógeno carbonatos o alcóxidos, que incluyen cationes adecuados, derivados por ejemplo de metales alcalinos, metales alcalinoterreos o cationes orgánicos, por ejemplo $[NH_nR_{4-n}]^+$, en las cuales n es 0, 1, 2, 3 o 4 y R representa un radical alquilo C₁₋₄ ramificado o lineal. Medios de reacción adecuados son, por ejemplo, los indicados anteriormente.
- Los solvatos, preferiblemente hidratos, de los compuestos sulfonamídicos derivados de benzoxazinona de fórmula general (I), o las sales correspondientes, también pueden ser obtenidos por métodos convencionales conocidos en el estado de la técnica.
- Si los compuestos derivados de benzoxazinona de fórmula general (I) se obtienen en forma de mezcla de estereoisómeros, particularmente enantiómeros o diasterómeros, dichas mezclas pueden separarse mediante métodos convencionales conocidos en el arte de la técnica, por ejemplo métodos cromatográficos o cristalización con agentes quirales.
- La purificación y el aislamiento de los compuestos sulfonamídicos derivados de benzoxazinona de fórmula general (I) o su estereoisómero correspondiente, o sal, o solvato respectivamente, si es necesario, pueden realizarse mediante métodos convencionales conocidos en el estado de la técnica, por ejemplo métodos cromatográficos o recristalización.

Los compuestos sulfonamídicos derivados de benzoxazinona de fórmula general (I), sus estereoisómeros, las sales correspondientes y los solvatos correspondientes son toxicológicamente aceptables y son por tanto adecuados como principios activos farmacéuticos para la preparación de medicamentos.

5

Por tanto, la presente invención también proporciona un medicamento que comprende al menos un compuesto sulfonamídico derivado de benzoxazinona de fórmula general (I), opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, su racemato o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, en cualquier relación de mezcla, o una de sus sales fisiológicamente aceptables, o un solvato correspondiente, y opcionalmente uno o más adyuvantes farmacéuticamente aceptables.

10

15

Además, la presente invención también proporciona una composición farmacéutica que comprende al menos un compuesto sulfonamídico derivado de benzoxazinona de fórmula general (I), opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, su racemato o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros en cualquier relación de mezcla, o una de sus sales fisiológicamente aceptables, o un solvato correspondiente y opcionalmente uno o más adyuvantes farmacéuticamente aceptables, todavía no formulados en un medicamento.

20

25

Preferiblemente el medicamento es adecuado para la regulación del receptor 5-HT₆, para la mejora de la cognición, para la profilaxis y/o tratamiento de trastornos de la ingesta de alimentos, particularmente para la regulación del apetito, para el mantenimiento, aumento o reducción del peso corporal, para la profilaxis y/o tratamiento de obesidad, bulimia, anorexia, caquexia o diabetes de tipo II (Diabetes mellitus no insulino-dependiente), preferiblemente diabetes de tipo II, que es causada por obesidad, trastornos del sistema nervioso

30

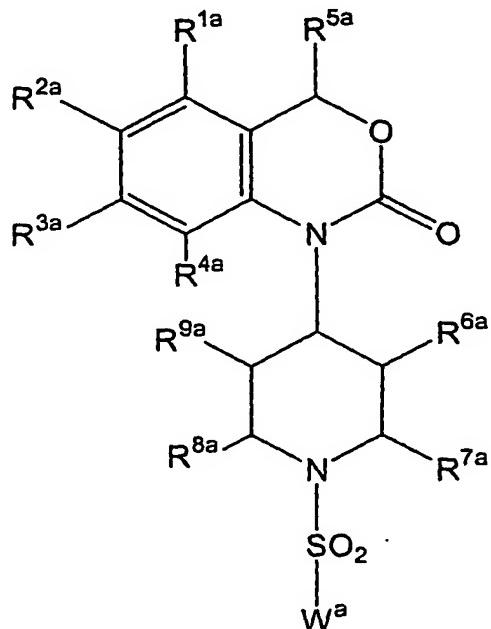
central, trastornos del aparato digestivo, como el síndrome del intestino irritable, ansiedad, pánico, depresión, trastornos cognitivos de la memoria, trastornos de demencia senil, como Morbus Alzheimer, Morbus Parkinson y Morbus Huntington, esquizofrenia, psicosis, hiperkinesia infantil, ADHC

5 (attention deficit, hyperactivity disorders) y otros trastornos mediados por 5-HT₆ humanos y animales, preferiblemente mamíferos, más preferiblemente humanos.

Otro aspecto de la presente invención es el uso de al menos un compuesto derivado de benzoxazinona de fórmula general (I) para la fabricación de un medicamento para la regulación del receptor 5-HT₆, para la mejora de la cognición, para la profilaxis y/o tratamiento de trastornos de la ingesta de alimentos, particularmente para la regulación del apetito, para el mantenimiento, aumento o reducción del peso corporal, para la profilaxis y/o

10 tratamiento de obesidad, bulimia, anorexia, caquexia o diabetes de tipo II (Diabetes mellitus no insulino-dependiente), preferiblemente diabetes de tipo II, que es causada por obesidad, trastornos del sistema nervioso central, trastornos del aparato digestivo, como el síndrome del intestino irritable, ansiedad, pánico, depresión, trastornos cognitivos de la memoria, trastornos de 15 demencia senil, como Morbus Alzheimer, Morbus Parkinson y Morbus Huntington, esquizofrenia, psicosis, hiperkinesia infantil, ADHC (attention deficit, hyperactivity disorders) y otros trastornos mediados por 5-HT₆ particularmente en mamíferos, incluido el hombre.

En otro aspecto, la presente invención también permite el uso de al menos un compuesto sulfonamídico derivado de benzoxazinona de fórmula general (Ia)



5

(Ia)

en la cual

10

R^{1a}, R^{2a}, R^{3a}, R^{4a} son cada uno seleccionados independientemente del grupo consistente en hidrógeno, halógeno, un radical alifático, lineal o ramificado, saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, un radical cicloalifático saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido,

15

opcionalmente contenido al menos un heteroátomo como miembro del anillo, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno opcionalmente al menos monosustituido, y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido, o un radical arilo o heteroarilo opcionalmente al menos monosustituido, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno opcionalmente al menos monosustituido y/o puede

20

condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido, un grupo nitro, ciano, -OR^{10a}, -O(C=O)R^{11a}, -(C=O)OR^{11a}, -SR^{12a}, -SOR^{12a}, -SO₂R^{12a}, -NH-SO₂R^{12a}, -SO₂NH₂ y -NR^{13a}R^{14a},

5 R^{5a} representa hidrógeno, un radical alifático opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado o un radical cicloalifático saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente conteniendo al menos un heteroátomo como miembro del anillo,

10 R^{6a}, R^{7a}, R^{8a}, R^{9a} son cada uno seleccionados independientemente del grupo consistente en hidrógeno, un radical alifático opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado, un radical cicloalifático saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, 15 opcionalmente conteniendo al menos un heteroátomo como miembro del anillo, un grupo ciano y un -COOR^{15a},

W^a representa un radical alifático opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado, un radical cicloalifático saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente 20 conteniendo al menos un heteroátomo como miembro del anillo, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno opcionalmente al menos monosustituido, y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido, un radical arilo o heteroarilo 25 opcionalmente al menos monosustituido, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno opcionalmente al menos monosustituido y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclico opcionalmente al menos monosustituido, un grupo NR^{16a}R^{17a} o un grupo COR^{18a},

R^{10a} representa hidrógeno, un radical alifático, lineal o ramificado, saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, un radical cicloalifático saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente conteniendo al menos un heteroátomo como miembro del anillo, que puede

- 5 enlazarse vía un grupo alquíleno opcionalmente al menos monosustituido, y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos
opcionalmente al menos monosustituido, o un radical arilo o heteroarilo
opcionalmente al menos monosustituido, que puede enlazarse vía un grupo
alquíleno opcionalmente al menos monosustituido y/o puede condensarse con
10 un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos
monosustituido,

R^{11a} representa hidrógeno, un radical alifático, lineal o ramificado, saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, un radical cicloalifático

- 15 saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente
conteniendo al menos un heteroátomo como miembro del anillo, que puede
enlazarse vía un grupo alquíleno opcionalmente al menos monosustituido, y/o
puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos
opcionalmente al menos monosustituido, o un radical arilo o heteroarilo
20 opcionalmente al menos monosustituido, que puede enlazarse vía un grupo
alquíleno opcionalmente al menos monosustituido y/o puede condensarse con
un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos
monosustituido,

25 R^{12a} representa un radical alifático, lineal o ramificado, saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, un radical cicloalifático saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente
conteniendo al menos un heteroátomo como miembro del anillo, que puede

- 30 enlazarse vía un grupo alquíleno opcionalmente al menos monosustituido, y/o
puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos
opcionalmente al menos monosustituido, o un radical arilo o heteroarilo
opcionalmente al menos monosustituido, que puede enlazarse vía un grupo

alquíleno opcionalmente al menos monosustituido y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido,

- 5 R^{13a} y R^{14a} son cada uno seleccionados independientemente del grupo consistente en hidrógeno, un radical alifático, lineal o ramificado, saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, un radical cicloalifático saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente conteniendo al menos un heteroátomo como miembro del anillo, que puede
10 enlazarse vía un grupo alquíleno opcionalmente al menos monosustituido, y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido, o un radical arilo o heteroarilo opcionalmente al menos monosustituido, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno opcionalmente al menos monosustituido y/o puede condensarse con
15 un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido,

o bien R^{13a} y R^{14a} junto con el átomo puente de nitrógeno forman un anillo heterocíclico saturado, insaturado o aromático, opcionalmente al menos monosustituido, que puede contener al menos un heteroátomo adicional como miembro del anillo,

20 R^{15a} representa hidrógeno, un radical alifático, lineal o ramificado, saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, un radical cicloalifático saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente conteniendo al menos un heteroátomo como miembro del anillo, o un radical arilo o heteroarilo, opcionalmente al menos monosustituido, que puede
25 enlazarse vía un grupo alquíleno opcionalmente al menos monosustituido, y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido,

30 R^{15a}

R^{16a} representa un radical alifático opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado, y

R^{17a} representa un radical alifático opcionalmente al menos monosustituido, 5 saturado o insaturado, lineal o ramificado,

R^{18a} representa un radical arilo opcionalmente al menos monosustituido,

10 opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, su racemato o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, en cualquier relación de mezcla, o una de sus sales fisiológicamente aceptables, o un solvato, respectivamente,

15 para la fabricación de un medicamento para la regulación del receptor 5-HT₆, para la mejora de la cognición, para la profilaxis y/o tratamiento de trastornos de la ingesta de alimentos, particularmente para la regulación del apetito, para el mantenimiento, aumento o reducción del peso corporal; para la profilaxis y/o tratamiento de obesidad, bulimia, anorexia, caquexia o diabetes de tipo II
20 (Diabetes mellitus no insulino-dependiente), preferiblemente diabetes de tipo II, que es causada por obesidad, trastornos del aparato digestivo, como el síndrome del intestino irritable, ansiedad, pánico, depresión, trastornos cognitivos de la memoria, trastornos de demencia senil, como Morbus Alzheimer, Morbus Parkinson y Morbus Huntington, esquizofrenia, psicosis, hiperkinesia infantil,
25 ADHC (attention deficit, hyperactivity disorders) y otros trastornos mediados por el receptor 5-HT₆ particularmente en mamíferos, incluido el hombre.

Si uno o más de los residuos R^{1a} - R^{17a} y W^a representa un radical alifático, que es sustituido por uno o más sustituyentes, a menos que se defina de otra forma, cada uno de estos sustituyentes puede seleccionarse preferiblemente del grupo consistente en hidroxi, halógeno, C₁₋₄-alcoxi ramificado o lineal, C₁₋₄-perfluoroalcoxi ramificado o lineal, C₁₋₄-perfluoroalquilo ramificado o lineal,

amino, carboxi, amido, ciano, nitro, $\text{-SO}_2\text{NH}_2$, $\text{-CO-C}_{1-4}\text{-alquilo}$, $\text{-SO-C}_{1-4}\text{-alquilo}$,
5 $\text{-SO}_2\text{-C}_{1-4}\text{-alquilo}$, $\text{-NH-SO}_2\text{-C}_{1-4}\text{-alquilo}$, en el cual el $\text{C}_{1-4}\text{-alquilo}$ puede en cada caso ser ramificado o lineal, un radical fenilo o naftilo no sustituido o al menos monosustituido y un radical furanilo, tienilo, pirrolilo, imidazolilo, pirazolilo,
10 piridinilo, pirimidinilo, quinolinilo e isoquinolinilo no sustituido o al menos monosustituido, seleccionado más preferiblemente del grupo consistente en hidroxi, F, Cl, Br, metoxi, etoxi, CF_3 y un radical fenilo no sustituido. Si cualquiera de los sustituyentes mencionados es en sí al menos monosustituido, dichos sustituyentes pueden preferiblemente seleccionarse del grupo consistente en F, Cl, metilo y metoxi.

Si uno o más de los residuos $\text{R}^{1a}\text{-R}^{15a}$ representa un radical cicloalifático, que es sustituido por uno o más sustituyentes, a menos que se defina de otra forma, cada uno de estos sustituyentes puede seleccionarse preferiblemente del grupo consistente en hidroxi, halógeno, $\text{C}_{1-4}\text{-alquilo}$ ramificado o lineal, $\text{C}_{1-4}\text{-alcoxi}$ ramificado o lineal, $\text{C}_{1-4}\text{-perfluoroalcoxi}$ ramificado o lineal, fenoxi, benzoilo, ciclohexilo, $\text{C}_{1-4}\text{-perfluoroalquilo}$ ramificado o lineal, $\text{-NR}^{\text{A}}\text{R}^{\text{B}}$ en el cual $\text{R}^{\text{A}}, \text{R}^{\text{B}}$ son cada uno independientemente seleccionados del grupo consistente en H, un radical $\text{C}_{1-4}\text{-alquilo}$ ramificado o lineal, $\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-OH}$ y Fenilo, carboxi, ceto, amido, ciano, nitro, $\text{-SO}_2\text{NH}_2$, $\text{-CO-C}_{1-4}\text{-alquilo}$, $\text{-CO-OC}_{1-4}\text{-alquilo}$, $\text{-SO-C}_{1-4}\text{-alquilo}$, $\text{-SO}_2\text{-C}_{1-4}\text{-alquilo}$, $\text{-NH-SO}_2\text{-C}_{1-4}\text{-alquilo}$, en el cual $\text{C}_{1-4}\text{-alquilo}$ puede en cada caso ser fenilo o naftilo, no sustituido o al menos monosustituido, ramificado o lineal y un radical furanilo, tienilo, pirrolilo, imidazolilo, pirazolilo, piridinilo, pirimidinilo, quinolinilo e isoquinolinilo no sustituido o al menos monosustituido, seleccionarse más preferiblemente del grupo consistente en hidroxi, F, Cl, Br, metilo-, etilo-, metoxi, etoxi, ceto, benzoilo, fenoxi, ciclohexilo, -CF_3 , -CO-CH_3 , -CO-OCH_3 , $\text{-NR}^{\text{A}}\text{R}^{\text{B}}$ en el cual $\text{R}^{\text{A}}, \text{R}^{\text{B}}$ son cada uno independientemente seleccionados del grupo consistente en H, un radical $\text{C}_{1-4}\text{-alquilo}$ ramificado o lineal, $\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-OH}$ y Fenilo, y un radical fenilo no sustituido. Si cualquiera de los sustituyentes mencionados es en sí al menos monosustituido, dichos sustituyentes pueden preferiblemente seleccionarse del grupo consistente en F, Cl, metilo y metoxi.

Si uno o más de los residuos R^{1a} - R^{4a} y R^{10a} - R^{15a} y W comprende un grupo alquíleno, que es sustituido por uno o más sustituyentes, a menos que se defina de otra forma, cada uno de estos sustituyentes puede seleccionarse preferiblemente del grupo consistente en hidroxi, halógeno, C₁₋₄-alcoxi ramificado o lineal, C₁₋₄-alquilo ramificado o lineal, C₁₋₄-perfluoroalcoxi ramificado o lineal, C₁₋₄-perfluoroalquilo ramificado o lineal, amino, carboxi, amido, ciano, nitro, -SO₂NH₂, -CO-C₁₋₄-alquilo, -SO-C₁₋₄-alquilo, -SO₂-C₁₋₄-alquilo, -NH-SO₂-C₁₋₄-alquilo, en el cual C₁₋₄-alquilo puede ser ramificado o lineal, un radical fenilo o naftilo no sustituido o al menos monosustituido y un radical furanilo, tienilo, pirrolilo, imidazolilo, pirazolilo, piridinilo, pirimidinilo, quinolinilo e isoquinolinilo no sustituido o al menos monosustituido, seleccionarse más preferiblemente del grupo consistente en hidroxi, F, Cl, Br, metilo-, metoxi, etoxi, CF₃ y fenilo no sustituido. Si cualquiera de los sustituyentes mencionados es en sí al menos monosustituido, dichos sustituyentes pueden preferiblemente seleccionarse del grupo consistente en F, Cl, metilo y metoxi.

Si uno o más de los residuos R^{1a} - R^{4a} y R^{10a} - R^{15a} comprende un sistema de anillo mono o policíclico, que es sustituido por uno o más sustituyentes, a menos que se defina de otra forma, cada uno de estos sustituyentes puede seleccionarse preferiblemente del grupo consistente en hidroxi, halógeno, C₁₋₄-alquilo ramificado o lineal, C₁₋₄-alcoxi ramificado o lineal, C₁₋₄-perfluoroalcoxi ramificado o lineal, C₁₋₄-perfluorocarbonilo ramificado o lineal, C₁₋₄-perfluoroalquilo ramificado o lineal, amino, carboxi, amido, ciano, ceto, nitro, -SO₂NH₂, -CO-C₁₋₄-alquilo, -SO-C₁₋₄-alquilo, -SO₂-C₁₋₄-alquilo, -NH-SO₂-C₁₋₄-alquilo, en el cual C₁₋₄-alquilo puede ser ramificado o lineal, un radical fenilo o naftilo no sustituido o al menos monosustituido y un radical furanilo, tienilo, pirrolilo, imidazolilo, pirazolilo, piridinilo, pirimidinilo, quinolinilo e isoquinolinilo no sustituido o al menos monosustituido, más preferiblemente del grupo consistente en hidroxi, F, Cl, Br, metilo-, etilo-, metoxi, etoxi, CF₃, -(C=O)-CF₃, ceto, ciano y un radical fenilo no sustituido. Si cualquiera de los sustituyentes

mencionados es en sí al menos monosustituido, dichos sustituyentes pueden preferiblemente seleccionarse del grupo consistente en F, Cl, metilo y metoxi.

Si uno o más de los residuos R^{1a} - R^{4a} , R^{10a} - R^{15a} y R^{18a} representa o comprende

5 un radical arilo, que es sustituido por uno o más sustituyentes, a menos que se defina de otra forma, cada uno de estos sustituyentes puede seleccionarse preferiblemente del grupo consistente en hidroxi, halógeno, C_{1-4} -alcoxi ramificado o lineal, C_{1-4} -alquilo ramificado o lineal, C_{1-4} -perfluoroalcoxi ramificado o lineal, fenoxi no sustituido o al menos monosustituido, benzoilo no sustituido o al menos monosustituido, ciclohexilo, C_{1-4} -perfluoroalquilo ramificado o lineal, $NR^A R^B$ en el cual R^A , R^B son cada uno independientemente seleccionados del grupo consistente en H, un radical C_{1-4} -alquilo ramificado o lineal, - CH_2-CH_2-OH y fenilo, carboxi, amido, ciano, - $CH(OH)(fenilo)$, nitro, - SO_2NH_2 , -CO- C_{1-4} -alquilo, -CO-OC C_{1-4} -alquilo, -SO-C C_{1-4} -alquilo, -SO 2 -C C_{1-4} -alquilo, -NH-SO 2 -C C_{1-4} -alquilo, en el cual C C_{1-4} -alquilo puede ser ramificado o lineal, un radical fenilo o naftilo no sustituido o al menos monosustituido y un radical-furanilo, tienilo, pirrolilo, imidazolilo, pirazolilo, piridinilo, pirimidinilo, quinoliniloo e isoquinoliniloo no sustituido o al menos monosustituido, seleccionarse más preferiblemente del grupo consistente en hidroxi, F, Cl, Br, metilo-, etilo-, ciano, nitro, - $CH(OH)(fenilo)$, metoxi, etoxi, benzoilo no sustituido o al menos monosustituido, fenoxi no sustituido o al menos monosustituido, ciclohexilo, CF $_3$, OCF $_3$, -CO-CH $_3$, -CO-OCH $_3$, SO 2 -CH $_3$, -NR $^A R^B$ en el cual R A , R B son cada uno independientemente seleccionados del grupo consistente en H, un radical C_{1-4} -alquilo ramificado o lineal, - CH_2-CH_2-OH y fenilo, y un radical 20 fenilo no sustituido. Si cualquiera de los sustituyentes mencionados es en sí al menos monosustituido, dichos sustituyentes pueden preferiblemente seleccionarse del grupo consistente en F, Cl, Br, CF $_3$, OCF $_3$, metilo y metoxi.

25

Si uno o más de los residuos R^{1a} - R^{4a} y R^{10a} - R^{15a} representa o comprende un

30 radical heteroarilo, que es sustituido por uno o más sustituyentes, a menos que se defina de otra forma, cada uno de estos sustituyentes puede seleccionarse preferiblemente del grupo consistente en hidroxi, halógeno, C_{1-4} -alcoxi

- ramificado o lineal, C₁₋₄-alquilo ramificado o lineal, C₁₋₄-perfluoroalcoxi
ramificado o lineal, fenoxi no sustituido o al menos monosustituido, benzoilo no
sustituido o al menos monosustituido, ciclohexilo, C₁₋₄-perfluoroalquilo
ramificado o lineal, NR^AR^B en el cual R^A, R^B son cada uno independientemente
5 seleccionados del grupo consistente en H, un radical C₁₋₄-alquilo ramificado o
lineal, -CH₂-CH₂-OH y fenilo, carboxi, amido, ciano, -CH(OH)(fenilo), nitro, -
SO₂NH₂, -CO-C₁₋₄-alquilo, -CO-OC₁₋₄-alquilo, -SO-C₁₋₄-alquilo, -SO₂-C₁₋₄-
alquilo, -NH-SO₂-C₁₋₄-alquilo, en el cual C₁₋₄-alquilo puede ser ramificado o
lineal, un radical fenilo o naftilo no sustituido o al menos monosustituido y un
10 radical furanilo, tienilo, pirrolilo, imidazolilo, pirazolilo, piridinilo, pirimidinilo,
quinolinilo e isoquinolinilo no sustituido o al menos monosustituido,
seleccionado más preferiblemente del grupo consistente en hidroxi, F, Cl, Br,
metilo-, etilo-, ciano, nitro, -CH(OH)(fenilo), metoxi, etoxi, benzoilo no sustituido
o al menos monosustituido, fenoxi no sustituido o al menos monosustituido,
15 ciclohexilo, CF₃, OCF₃, -CO-CH₃, -CO-OCH₃, SO₂-CH₃, -NR^AR^B en el cual R^A,
R^B son cada uno independientemente seleccionados del grupo consistente en
H, un radical C₁₋₄-alquilo ramificado o lineal, -CH₂-CH₂-OH y fenilo, y un radical
fenilo no sustituido. Si cualquiera de los sustituyentes mencionados es en sí al
menos monosustituido, dichos sustituyentes pueden preferiblemente
20 seleccionarse del grupo consistente en F, Cl, Br, CF₃, OCF₃, metilo y metoxi.

- Si R^{13a} y R^{14a} forman un anillo heterocíclico, que es sustituido por uno o más
sustituyentes, a menos que se defina de otra forma, cada uno de estos
sustituyentes puede seleccionarse preferiblemente del grupo consistente en
25 hidroxi, halógeno, C₁₋₄-alcoxi ramificado o lineal, C₁₋₄-alquilo ramificado o lineal,
C₁₋₄-perfluoroalcoxi ramificado o lineal, C₁₋₄-perfluoroalquilo ramificado o lineal,
amino, carboxi, amido, ciano, nitro, -SO₂NH₂, -CO-C₁₋₄-alquilo, -SO-C₁₋₄-alquilo,
-SO₂-C₁₋₄-alquilo, -NH-SO₂-C₁₋₄-alquilo, en el cual C₁₋₄-alquilo puede ser
ramificado o lineal, un radical fenilo o naftilo no sustituido o al menos
monosustituido y un radical furanilo, tienilo, pirrolilo, imidazolilo, pirazolilo,
30 piridinilo, pirimidinilo, quinolinilo e isoquinolinilo no sustituido o al menos
monosustituido, seleccionarse más preferiblemente del grupo consistente en

hidroxi, F, Cl, Br, metoxi, etoxi, metilo-, CF₃ y un radical fenilo no sustituido. Si cualquiera de los sustituyentes mencionados es en sí al menos monosustituido, dichos sustituyentes pueden preferiblemente seleccionarse del grupo consistente en F, Cl, metilo y metoxi.

5

Si R^{13a} y R^{14a} forman un anillo heterocíclico, que contiene uno o más heteroátomos adicionales como miembros del anillo, a menos que se defina de otra forma, cada uno de estos heteroátomos puede preferiblemente seleccionarse del grupo consistente en N, O y S, más preferiblemente del grupo consistente en N y O.

10

Si uno o más de los residuos R^{1a}-R^{15a} y W^a representa un radical cicloalifático, que contiene uno o más heteroátomos como miembros del anillo, a menos que se defina de otra forma, cada uno de estos heteroátomos puede

15

preferiblemente seleccionarse del grupo consistente en N, Q, S y P, más preferiblemente del grupo consistente en N, O y S.

20

Si uno o más de los residuos R^{1a}-R^{4a}, R^{10a}-R^{15a} y W^a representa o comprende un radical heteroarilo, que contiene uno o más heteroátomos como miembros del anillo, a menos que se defina de otra forma, cada uno de estos heteroátomos puede preferiblemente seleccionarse del grupo consistente en N, O, S y P, más preferiblemente del grupo consistente en N, O y S.

25

Si W^a representa o comprende un radical cicloalifático, un radical heteroarilo, un radical arilo y/o un sistema de anillos mono o policíclico, que es sustituido por uno o más sustituyentes, a menos que se defina de otra forma, cada uno de estos sustituyentes puede seleccionarse preferiblemente del grupo consistente en hidroxi, nitro, carboxi, ciano, ceto, halógeno, C₁₋₂₀-alquilo, C₁₋₄-alquilo parcialmente fluorado, C₁₋₄-alquilo parcialmente clorado, C₁₋₄-alquilo parcialmente bromado, C₁₋₅-alcoxi, C₁₋₄-alcoxi parcialmente fluorado, C₁₋₄-alcoxi parcialmente clorado, C₁₋₄-alcoxi parcialmente bromado, C₂₋₆-alquenilo, SO₂-C₁₋₄-alquilo, -(C=O)-C₁₋₅-alquilo, -(C=O)-O-C₁₋₅-alquilo, -(C=O)-Cl, -S-C₁₋₄-alquilo, -

30

- (C=O)-H, -NH-(C=O)-NH-C₁₋₅-alquilo, -(C=O)-C₁₋₄-perfluoroalquilo, -NR^AR^B, en el cual R^A y R^B son independientemente seleccionados del grupo consistente en H, C₁₋₄-alquilo y fenilo, NH-(C=O)-C₁₋₅-alquilo, -C₁₋₅-alquilen-(C=O)-C₁₋₅-alquilo, (1,3-Dihidro-1-oxo-2H-isoindol-2-ilo), N-ftalimidinil-, (1,3-Dioxo-2-azaspiro[4,4]-non-2-ilo, fenilo sustituido o no sustituido, -SO₂-fenilo, fenoxy, piridinilo, piridiniloxi, pirazolilo, pirimidinilo, pirrolidinilo, -SO₂-pirrolidinilo, morfolinilo, SO₂-morpholinilo, tiadiazolilo, oxadiazolilo, oxazolilo, tiazolilo, isoxazolilo, O-CH₂-tiazolilo, -, NH-fenilo, y -C₁₋₄-Alquilen-NH-(C=O)-fenilo, más preferiblemente del grupo consistente en hidroxi, nitro, carboxi, ciano, ceto, F, Cl, Br, I, C₁₋₁₂-alquilo, CH₂F, CHF₂, CF₃, CH₂Cl, CH₂Cl₂, CCl₃, CH₂Br, CHBr₂, CBr₃, OCF₃, OCHF₂, OCH₂F, O-CH₂-CF₃, vinilo, SO₂-CH₃, -(C=O)-CH₃, -(C=O)-C₂H₅, -(C=O)-O-CH₃, -(C=O)-O-C₂H₅, -(C=O)-Cl, -S-CH₃-, -(C=O)-H, -NH-(C=O)-NH-CH₃, -(C=O)-CF₃, dimetilamino, dietilamino, di-n-propilamino, di-isopropilamino, di-n-butilamino, di-tert-butilamino, NH-(C=O)-CH₃, -CH₂-(C=O)-CH₃, -CH₂-(C=O)-C₂H₅, (1,3-Dihidro-1-oxo-2H-isoindol-2-ilo), N-Ftalimidinil-, (1,3-Dioxo-2-azaspiro[4,4]-non-2-ilo, fenilo sustituido o no sustituido, -SO₂-fenilo, fenoxy, piridinilo, piridiniloxi, pirazolilo, pirimidinilo, pirrolidinilo, -SO₂-pirrolidinilo, morpholinilo, SO₂-morpholinilo, tiadiazolilo, oxadiazolilo, oxazolilo, tiazolilo, isoxazolilo, O-CH₂-tiazolilo, NH-fenilo, y -CH₂-NH-(C=O)-fenilo.
- Si cualquiera de los sustituyentes mencionados en sí mismo es sustituido por uno o más sustituyentes, dichos sustituyentes pueden preferiblemente seleccionarse del grupo consistente en halógeno, nitro, ciano, hidroxi, -(C=O)-C₁₋₄-alquilo, C₁₋₄-alquilo, C₁₋₄-alquilo al menos parcialmente fluorado, C₁₋₄-alquilo al menos parcialmente clorado, C₁₋₄-alquilo al menos parcialmente bromado, -S-C₁₋₄-alquilo, -C(=O)-O-C₁₋₅-alquilo, -(C=O)-CH₂-F, -(C=O)-CH₂-Cl, -(C=O)-CH₂-Br, preferiblemente del grupo consistente en F, Cl, Br, CH₂F, CHF₂, CF₃, CH₂Cl, CHCl₂, CCl₃, CH₂Br, CHBr₂, CBr₃, nitro, ciano, hidroxi, -(C=O)-CH₃, CH₃, C₂H₅, -S-CH₃, -C(=O)-O-CH₃, -C(=O)-O-C₂H₅, -(C=O)-CH₂-F, -(C=O)-CH₂-Cl y -(C=O)-CH₂-Br.

- Preferido es el uso de compuestos de fórmula general (la), en la cual R^{1a}, R^{2a}, R^{3a}, R^{4a} son cada uno independientemente seleccionados del grupo consistente en H, F, Cl, Br, un radical alifático C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado, un radical
- 5 cicloalifático C_{3-C₈} saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente conteniendo al menos un heteroátomo como miembro del anillo, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno C_{1-C₆} opcionalmente al menos monosustituido, y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido,
- 10 un radical arilo o heteroarilo de 5 o 6 miembros opcionalmente al menos monosustituido, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclico opcionalmente al menos monosustituido, un grupo nitro, ciano, -OR^{10a}, -OC(=O)R^{11a}, -SR^{12a}, -SOR^{12a}, -SO₂R^{12a}, -NH-
- 15 SO₂R^{12a}, -SO₂NH₂ y -NR^{13a}R^{14a},
- preferiblemente seleccionados del grupo consistente en H, F, Cl, Br, un radical alifático C₁₋₃ opcionalmente al menos monosustituido, ramificado o lineal, saturado, un radical cicloalifático C₅ o C₆ saturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente conteniendo al menos un heteroátomo como miembro del anillo, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno C₁ o C₂ opcionalmente al menos monosustituido, un grupo nitro, ciano, -OR^{10a}, -OC(=O)R^{11a}, -SR^{12a} y -NR^{13a}R^{14a},
- 20
- 25 más preferiblemente seleccionados del grupo consistente en H, F, Cl, CH₃, CH₂CH₃, CF₃, CF₂CF₃, ciclopentilo, ciclohexilo, nitro, ciano y -OR^{10a}, y R^{5a}-R^{18a} y W^a tienen la significación definida anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, sus racematos o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, en cualquier relación de mezcla, o sus sales correspondientes, o solvatos correspondientes.
- 30

También preferido es el uso de compuestos de fórmula general (Ia), en la cual R^{5a} representa hidrógeno, un radical alifático C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado o un radical cicloalifático C_{3-C₈} saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente conteniendo al menos un heteroátomo como miembro del anillo,

5 más preferiblemente representando H o un radical alquilo C₁₋₃ ramificado o lineal,

preferiblemente representando H o un radical alquilo C₁₋₃ ramificado o lineal,

10 más preferiblemente H, CH₃ o CH₂CH₃,

y R^{1a}-R^{4a}, R^{6a}-R^{18a} y W^a tienen la significación indicada anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, sus racematos o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, en cualquier relación de mezcla, o sus sales correspondientes, o solvatos correspondientes.

15 También preferido es el uso de compuestos de fórmula general (Ia), en la cual R^{6a}, R^{7a}, R^{8a}, R^{9a} son cada uno independientemente seleccionados del grupo consistente en hidrógeno, un radical alifático C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado, un radical cicloalifático C_{3-C₈} saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente conteniendo al menos un heteroátomo como miembro del anillo, un grupo ciano y un grupo COOR^{15a},

20 preferiblemente seleccionados del grupo consistente en H, un radical alquilo C₁₋₃ ramificado o lineal, un ciano y un grupo COOR^{15a},

25 más preferiblemente del grupo consistente en H, CH₃, CH₂CH₃ y un grupo ciano, y R^{1a}-R^{5a}, R^{10a}-R^{18a} y W^a tienen la significación indicada anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente

enantiómeros o diasterómeros, sus racematos o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, en cualquier relación de mezcla, o sus sales correspondientes, o solvatos correspondientes.

5

También preferido es el uso de compuestos de fórmula general (Ia), en la cual W^a representa un radical alifático C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado, un radical cicloalifático C_{3-C₈} saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente conteniendo al menos un heteroátomo como miembro del anillo, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno C_{1-C₆} opcionalmente al menos monosustituido, y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido, un radical arilo o heteroarilo de 5 o 6 miembros opcionalmente al menos monosustituido, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclico opcionalmente al menos monosustituido, un grupo NR^{16a}R^{17a} o un grupo COR^{18a}.

20

preferiblemente se selecciona del grupo consistente en 1-Naftil-, 5-Dimetilamino-1-naftil, 2-Naftil-, 2-Acetamido-4-metil-5-tiazolil-, 2-Tienil-, 8-Quinolinil-, Fenil-, Pentafluorofenil-, 2,4,5-Tricloro-fenil-, 2,5-Dicloro-fenil-, 2-Nitrofenil-, 2,4-Dinitro-fenil-, 3,5-Dicloro-2-hidroxi-fenil-, 2,4,6-Trisisopropil-fenil-, 2-Mesitil-, 3-Nitro-fenil-, 4-Bromo-fenil-, 4-Fluoro-fenil-, 4-Clorofenil-, 4-Cloro-3-nitro-fenil-, 4-Iodo-fenil-, N-Acetilsulfanilil-, 4-Nitro-fenil-, 4-Metoxi-fenil-, Ácido benzoico-4-il-, 4-tert-Butil-fenil-, p-Tolil-, Trifluorometil-, Triclorometil-, Isopropil-, Metil-, Bencil-, trans-estiril-, 2,2,2-Trifluoroetil-, Etil-, Hexadecil-, 2-Cloroetil-, n-Propil-, 3-Cloro-propil-, n-Butil-, Metil-benzoato-2-il-, 2-Nitro-4-(trifluorometil)-fenil-, Pentametil-fenil-, 2,3,5,6-Tetrametil-fenil-, 3-(Trifluorometil)-fenil-, 3,5-Bis-(Trifluorometil)-fenil-, Diclorometil-, Clorometil-, Dodecil-, 1-Octil-, 2,3,4-Tricloro-fenil-, 2,5-Dimetoxi-fenil-, o-Tolil-, p-xilil-2-il-, Ácido benzoico-3-il-, 4-Cloro-3-(trifluorometil)-fenil-, ácido 4-cloro-5-nitro-benzoico-3-il-, 6-(p-toluidin)-2-naftil-,

4-Metoxi-2,3,6-trimetilfenil-, 3,4-Diclorofenil-, 4,5-Dibromo-tiofen-2-il-, 3-Cloro-4-fluoro-fenil-, 4-Etil-fenil-, 4-n-Propil-fenil-, 4-(1,1-Dimetilopropil)-fenil-, 4-Isopropil-fenil-, 4-Bromo-2,5-difluoro-fenil-, 2-Fluoro-fenil-, 3-Fluoro-fenil-, 4-(Trifluorometoxi)-fenil-, 4-(Trifluorometil)-fenil-, 2,4-Difluoro-fenil-, 2,4-Dicloro-5-metil-fenil-, 4-Cloro-2,5-dimetil-fenil-, 5-Dietilamino-2-naftil-, Cloruro de benzoil-3-il-, 2-Cloro-fenil-, 1-Octadecil-, 4-Bromo-2,5-dicloro-tiofen-3-il-, 2,5-Dicloro-tiofen-3-il-, 5-Cloro-tiofen-2-il-, 2-Metil-5-nitro-fenil-, 2-(Trifluorometil)-fenil-, 3-Cloro-fenil-, 3,5-Dicloro-fenil-, 1-Decil-, 3-Metil-fenil-, 2-Cloro-6-metil-, 5-Bromo-2-metoxi-fenil-, 3,4-Dimetoxi-fenil-, 2-3-Dicloro-fenil-, 2-Bromo-fenil-, 3,5-Dicloro-4-(2-cloro-4-nitrofenoxi)-fenil-, 2,3-Dicloro-tiofen-5-il-, 3-Bromo-2-cloro-tiofen-5-il-, 3-Bromo-5-cloro-tiofen-2-il-, 2-(Benzoiloaminometil)-tiofen-5-il-, 4-(Fenilsulfonil)-tiofen-2-il-, 2-Fenilsulfoniltiofen-5-il-, 3-Cloro-2-metil-fenil-, 2-[1-Metil-5-(trifluorometilo)pirazol-3-il]-tiofen-5-il-, 5-Pirid-2-il-tiofen-2-il-, 2-Cloro-5-(trifluorometil)-fenil-, 2,6-Dicloro-fenil-, 3-Bromo-fenil-, 2-(Trifluorometoxi)-fenil-, 4-Ciano-fenil-, 2-Ciano-fenil-, 4-n-Butoxi-fenil-, 4-Acetamido-3-cloro-fenil-, 2,5-Dibromo-3,6-difluoro-fenil-, 5-Cloro-1,3-dimetilopirazol-4-il-, 3,5-Dimetilisoxazol-4-il-, 2-(2,4-Diclorofenoxi)-fenil-, 4-(2-Cloro-6-nitro-fenoxy)-fenil-, 4-(3-Cloro-2-ciano-fenoxy)-fenil-, 2,4-Dicloro-fenil-, 2,4-Dimetil-1,3-tiazol-5-il-, Metil-metano-sulfonil-, 2,5-Bis-(2,2,2-Trifluoroetoxi)-fenil-, 2-Cloro-4-(trifluorometil)-fenil-, 2-Cloro-4-fluoro-fenil-, 5-Fluoro-2-metil-fenil-, 5-Cloro-2-metoxi-fenil-, 2,4,6-Tricloro-fenil-, ácido-2-hidroxi-benzoico-5-il-, 5-(Di-n-propilamino)-1-naftil-, 6-Metoxi-m-tolil-, 2,5-Difluoro-fenil-, 2,4-Dimetoxi-fenil-, 2,5-Dibromo-fenil-, 3,4-Dibromo-fenil-, 2,2,5,7,8-Pentametil-croman-6-il-, ácido-2-metoxi-benzoico-5-il-, 5-Cloro-4-nitro-tiofen-2-il-, 2,1,3-Benzotiadiazol-4-il-, 1-Metil-imidazol-4-il-, 25-Benzofurazan-4-il-, 2-(Metoxicarbonil)-tiofen-3-il-, 5-(Isoxazol-3-il)-tiofen-2-il-, 2,4,5-Trifluoro-fenil-, Bifenil-4-il-, Vinil-fenil-4-il-, 2-Nitro-bencil-, 5-Dicloro-metil-furan-2-il-, 5-Bromo-tiofen-2-il-, 5-(4-Clorobenzoamidometil)-tiofen-2-il-, 2,6-Difluoro-fenil-, 2,5-Dimetoxi-4-nitro-fenil-, Dibenzo[b,d]-furan-2-il-, 2,3,4-Trifluoro-fenil-, 3-Nitro-p-tolil-, 4-Metoxi-2-nitro-fenil-, 3,4-Difluoro-fenil-, 4-(Bromoetil)-fenil-, 3,5-Dicloro-4-hidroxi-fenil-, 4-n-Amilofenil-, 5-Cloro-3-metilbenzo[b]-tiofen-2-il-, 3-Metoxi-4-(metoxicarbonil)-tiofen-2-il-, 4-n-Butil-fenil-, 2-Cloro-4-ciano-fenil-, 5-[2-(Metiltio)-pirimidin-4-il]-tiofen-2-il-, 3,5-Dinitro-4-

metoxi-fenil-, 4-Bromo-2-(trifluorometoxi)-fenil-, 4-Cloro-2,1,3-Benzoxadiazol-7-il-, 2-(1-Naftil)-etil-, 3-Ciano-fenil-, 5-Cloro-2,1,3-Benzoxadiazol-4-il-, 3-Cloro-4-metil-fenil-, 4-Bromo-2-etil-fenil-, 2,4-Dicloro-6-metil-fenil-, 6-Cloro-imidazo(2,1-b)-tiazol-5-il-, 3-Metil-benzo[b]-tiofeno-2-il-, 4-Metil-sulfonil-fenil-, 2-Metil-sulfonil-fenil-, 4-Bromo-2-metil-fenil-, 2,6-Dicloro-4-(trifluorometil)-fenil-, 4-[3-Cloro-5-(trifluorometil)-2-piridinilo]oxi]-fenil-, 5-Cloro-nafta-1-il-, 5-Cloro-2-naftil-, 9,10-Dibromoantracen-2-il-, Isoquinolin-5-il-, 4-Metoxi-2,3,6-trimetil-fenil-, 4'-Nitro-bifenil-4-il-, [(4-Fenoxi)-fenil-, (1,3-Dihidro-1-oxo-2H-isoindol-2-il)-4-fenil-, 4-Acetil-fenil-, 5-(2-Metil-1,3-tiazol-4-il)-tiofen-2-il-, 5-(1-Metil-3-trifluorometilo)pirazol-5-il]-tiofen-2-il-, 5-[5-Trifluorometil]-isoxazol-3-il]-tiofen-2-il-, 2-Iodo-fenil-, p-Dodecilfenil-, 4-[(3-Ciano-4-metoxi-2-piridinilo)oxi]-fenil-, 4-(N-ftalimidinil)-fenil-, 1,2,3,4-Tetrahidro-2-(trifluoroacetil)-isoquinolin-7-il-, 4-Bromo-2-fluoro-fenil-, 2-Fluoro-5-(trifluorometil)-fenil-, 4-Fluoro-2-(trifluorometil)-fenil-, 4-Fluoro-3-(trifluorometil)-fenil-, 2,4,6-Trifluoro-fenil-, 3-(Trifluorometoxi)-fenil-, 1,2-Dimetilimidazol-4-il-, Etil-4-Carboxilato-3-il-, 2,2,4,6,7-Pentametildihidrobenzofuran-5-il-, 3-Bromo-2-cloropiridin-5-il-, 3-Metoxi-fenil-, 2-Metoxi-4-metil-fenil-, ácido 2-Cloro-4-fluoro benzoico-5-il-, 4-Cloro-1-naftil-, 2,5-Dicloro-4-nitro-tiofen-3-il-, 4-(4-Metoxi-fenoxi)-fenil-, 4-(4-Cloro-fenoxi)-fenil-, 4-(3,5-Dicloro-fenoxi)-fenil-, 4-(3,4-Dicloro-fenoxi)-fenil-, 4-(4-Fluoro-fenoxi)-fenil-, 4-(4-Metil-fenoxi)-fenil-, 4-[4-(Trifluorometil)-fenoxi-fenil-, 4-[3,5-Bis-(trifluorometil)-fenoxi]-fenil-, 3-(2-Metoxi-fenoxi)-fenil-, [3-(2-Cloro-fenoxi)-fenil-, 3-(2-Metil-fenoxi)-fenil-, 4-[2-(Trifluorometil)-fenoxi]-fenil-, 3-Fenil-fenil-, 3-(4-Metoxi-fenil)-fenil-, 3-(4-Cloro-fenil)-fenil-, 3-(3,5-Dicloro-fenil)-fenil-, 3-(3,4-Dicloro-fenil)-fenil-, 3-(4-Fluorofenil)-fenil-, 3-(4-Metilfenil)-fenil-, 3-[4-(Trifluorometil)-fenil]-fenil-, 3-[3,5-Bis-(trifluorometil)-fenil]-fenil-, 4-(4-Piridiloxi)-fenil-, 4-(2-Metoxi-fenoxi)-fenil-, 4-(2-Cloro-fenoxi)-fenil-, 4-(2-Metil-fenoxi)-fenil-, 4-(4-Metoxi-fenoxi)-fenil-, 4-(4-Clorofenil)-fenil-, 4-(3,5-Diclorofenil)-fenil-, 4-(3,4-Diclorofenil)-fenil-, 4-(4-Fluorofenil)-fenil-, 4-(4-Metilfenil)-fenil-, 4-[4-(Trifluorometil)-fenil]-fenil-, 4-[3,5-Bis-(Trifluorometil)-fenil]-fenil-, [3-(Trifluorometil)-fenil]-metil-, (4-Clorofenil)-metil-, (3,5-Diclorofenil)-metil-, (3,5-Diclorofenil)-metil-, (4-Fluorofenil)-metil-, 4-Metilfenilometil-, [4-(Trifluorometil)-fenil]-metil-, Ciclopropil-, 2-(2-Clorofenil)-2-feniletil-, 2-(2-Trifluorometilfenil)-2-

feniletil-, 5-[4-Ciano-1-metil-5-(metiltio)-1H-pirazol-3-il-tiofen-2-il-, 3-Ciano-2,4-bis-(2,2,2-Trifluorotoxi)-fenil-, 4-[(2-Cloro-1,3-Tiazol-5-il)-metoxi]-fenil-, 3-Nitrofenilmetil-, 4-Formilfenil-, 2-(1,3-Dioxo-1,3-dihidro-isoindol-2-il)-etil-, [3,5-Bis-(Trifluorometil)-fenil]-metil-, (4-(2-Piridiloxi)-fenil)-, (4-(3-Piridiloxi)-fenil)-, 5-Iodo-1-naftil-, Etil-2,5-dimetil-1-fenilopirrol-4-carboxilato-3-il-, Etil-2-metil-1,5-difenil-1H-pirrol-3-carboxilato-4-il-, Etil-5-(4-clorofenil)-2-metil-3-furoato-4-il, Etil-5-(4-clorofenil)-2-metil-1-fenil-3-carboxilato-4-il-, Etil-2,5-dimetil-3-furoato-4-il-, 3-Cloro-4-(1,3-dioxo-2-azaspiro[4,4]non-2-il)-fenil-, 5-Bromo-2,4-difluoro-fenil-, 5-Cloro-2,4-difluorofenil-, Coumarin-6-il, 2-Metoxi-fenil-, (3-Fenoxy)-fenil-, 3-(4-Metoxi-fenoxy)-fenil-, 3-(4-Clorofenoxy)-fenil-, 3-(3,5-Diclorofenoxy)-fenil-, 3-(3,4-Diclorofenoxy)-fenil-, 3-(4-Fluorofenoxy)-fenil-, 3-(4-Metilfenoxy)-fenil-, 3-[4-(Trifluorometil)-fenoxi]-fenil-, 3-[3,5-(Trifluorometil)-fenoxi]-fenil-, 3-[2-(Trifluorometil)-fenoxi]-fenil-, 2,2-Difeniletil-, 4-Fenil-5-(trifluorometil)-tiofen-3-il-, Metil-4-fenil-5-(Trifluorometil)-tiofen-2-carboxilato-3-il-, Metil-1,2,5-trimetilpirrol-3-carboxilato-4-il-, 4-Fluoro-1-naftil-, 3,5-Difluorofenil-, 3-Fluoro-4-metoxi-fenil-, 4-Cloro-2,5-difluorofenil-, 2-Cloro-4,5-difluoro-fenil-, 5-Fluoro-3-metilbenzo[b]-tiofeno-2-il-, Metil-3-fenilopropionato-4-il, Ácido dihidrocinámico-4-il-, Metil-2,5-dimetil-3-furoato-4-il-, Metil-2-furoato-5-il-, Metil-2-metil-3-furoato-5-il-, Metil-1-metil-1H-pirrol-2-carboxilato-5-il-, 2-(5-Cloro-1,2,4-tiadiazol-3-il)-tiofen-5-il-, 1,3,5-Trimetil-1H-pirazol-4-il-, 3-Cloro-5-fluoro-2-Metilfenil-, Pentafluoroetoxitetrafluoroetyl-, 5-(5-Isoxacil)-tiofen-2-il-, 5-(5-Isoxazol-il)-2-furil-, 5-Metil-2,1,3-benzotiadiazol-4-il-, Bifenil-2-il-, 2,3-Dihidro-1,4-benzodioxine-6-il-, 4-Metil-1-Naftil-, 5-Metil-2-(trifluorometil)-3-furil-, 2,3-Dihidrobenzo[b]furan-5-il-, 1-Benzotiofen-3-il-, 4-Metil-3,4-dihidro-2H-1,4-Benzoxazin-7-il-, 5-Metil-1-fenil-1H-pirazol-4-il-, 6-Morfolin-3-piridinil-, 4-(1H-Pirazol-1-il)-fenil-, 6-Fenoxy-3-piridil-, 3,4-Dihidro-2H-1,5-benzodioxepina-7-il-, 5-(1,3-Oxazol-5-il)-2-tienil-, 4-(1,3-Oxazol-5-il)-fenil-, 5-Metil-4-isoxazolil-, 2,1,3-Benzotiadiazo-5-il-, 3-Tienil-, 2-metil-bencil-, 3-Cloro-bencil-, 5-Acetamido-1-naftil-, 3-Metil-8-quinolinil-, 4-Cloro-2-nitrofenil-, 6-Quinolinil-, 1,3-Benzotiazol-6-il-, 2-Morfolin-3-piridil-, 2,5-Dimetil-3-tienil-, 5-[5-(Clorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]-2-tienil-, Etil-3-[5-il-2-tienilo]1,2,4-oxadiazol-5-carboxilato-, 3-(5-Metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-fenil-, 4-Isopropoxifenil-, 2,4-Dibromofenil-, 3-Ciano-4-fluorofenil-, 2,5-Bis-

(trifluorometil)-fenil-, 2-Bromo-4-fluorofenil-, 4-Bromo-3-fluorofenil-, 4-(Difluorometoxi)-fenil-, 3-(Difluorometoxi)-fenil-, 5-Cloro-2-fluoro-fenil-, 3-Cloro-2-fluorofenil-, 2-Fluoro-4-metilfenil-, 4 Nitro-3-(trifluorometil)-fenil-, 3-Fluoro-4-metilfenil-, 4-Fluoro-2-metilfenil-, 4-Bromo-3-(trifluorometil)-fenil-, 4-Bromo-2-trifluorometil)-fenil-, 3-Bromo-5-(trifluorometil)-fenil-, 2-Bromo-4-(trifluorometil)-fenil-, 2-Bromo-5-(trifluorometil)-fenil-, 2,4-Dicloro-5-fluorofenil-, 4,5-Dicloro-2-fluorofenil-, 3,4,5-Trifluorofenil-, 4-Cloro-2-fluorofenil-, 2-Bromo-4,6-Difluorofenil-, 2-Etilfenil-, 4-Bromo-2-clorofenil-, 4-Bromo-2,6-diclorofenil-, 2-Bromo-4,6-dicloro-fenil-, 4-Bromo-2,6-dimetilfenil-, 3,5-Dimetilfenil-, 4-Bromo-3-Metilfenil-, 2-Metoxi-4-nitrofenil-, 2,2-Dimetil-6-cromanil-, Etil-3,5-dimetil-1H-pirrol-2-carboxilato-4-il-, Imidazo[1,2-a]piridin-3-il-, 3-(1,3-Oxazol-5-il)-fenil-, Etil-5-[4-il]-fenil]-2-metil-3-furoato, Metil-3-(il)-4-metoxibenzoato, 1-Pirrolidinilfenilsulfonil-, Metil-5-il-4-metil-2-tiofen-carboxilato, Metil-3-il-4-(isopropilsulfonil)-2-tiofeno, 2-Piridil-, 3-Fluoro-4-nitrofenil-, 7-Clorocroman-3-il-, 4'-Bromobifenil-4-il-, 4'-Acetilobifenil-4-il-, 4'-Bromo-2'-fluoro-bifenil-4-il-, 2-Cloro-4-(3-propil-ureido)-fenil-, 3-(Bromoacetil)-fenil-, 2-Bromo-3-(trifluorometil)-fenil-, 1-Metil-5-isatinil-, ácido 4-Isopropil-benzoico-3-il-, ácido 2-Cloro-3-tiofencarboxilico-5-il-, 3-Piridil-, ciclohexilometil-, 2-Metoxi-5-(N-ftalimidinil)-fenil-, 1-Benzotiofen-2-il-, Morfolinfenilsulfonil-, 3-(2-Metil-4-pirimidinil)-fenil-, y 2-Ciano-5-metilfenil-,

y R^{1a}-R^{15a}, tienen la significación indicada anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, sus racematos o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, en cualquier relación de mezcla, o sus sales correspondientes, o solvatos correspondientes.

Además, se prefiere el uso de compuestos de fórmula general (Ia), en la cual R^{10a} representa hidrógeno, un radical alifático C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado, un radical cicloalifático C₃-C₈ saturado o insaturado, opcionalmente al menos

- monosustituido, opcionalmente conteniendo al menos un heteroátomo como miembro del anillo, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno C₁-C₆ opcionalmente al menos monosustituido, y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido,
- 5 o un radical arilo o heteroarilo de 5 o 6 miembros, al menos monosustituido, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno C₁-₆ opcionalmente al menos monosustituido y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclico opcionalmente al menos monosustituido,
- 10 preferiblemente H, un radical alquilo C₁-4, ciclohexilo o un radical fenilo, más preferiblemente H, CH₃, C₂H₅ o fenilo,
- 15 y R^{1a}-R^{9a}, R^{12a}-R^{18a} y W^a tienen la significación indicada anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, sus racematos o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, en cualquier relación de mezcla, o sus sales correspondientes, o solvatos correspondientes.
- 20 Además, se prefiere el uso de compuestos de fórmula general (Ia), en la cual R^{11a} representa hidrógeno, un radical alifático C₁-₆ opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado, un radical cicloalifático C₃-C₈ saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente conteniendo al menos un heteroátomo como miembro del anillo, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno C₁-C₆ opcionalmente al menos monosustituido, y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido,
- 25 o un radical arilo o heteroarilo de 5 o 6 miembros, al menos monosustituido,
- 30 que puede enlazarse vía un grupo alquíleno C₁-₆ opcionalmente al menos monosustituido y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclico opcionalmente al menos monosustituido,

preferiblemente H, un radical alquilo C₁₋₄ lineal o ramificado, ciclohexilo o un radical fenilo, más preferiblemente H, CH₃, C₂H₅ o fenilo,

5 y R^{1a}-R^{10a}, R^{12a}-R^{18a} y W^a tienen la significación indicada anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, sus racematos o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, en cualquier relación de mezcla, o sus sales correspondientes, 10 o solvatos correspondientes.

También preferido es el uso de compuestos de fórmula general (Ia), en la cual R^{12a} representa un radical alifático C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado, un radical 15 cicloalifático C_{3-C₈} saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente conteniendo al menos un heteroátomo como miembro del anillo, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno C_{1-C₆} opcionalmente al menos monosustituido; y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido, 20 o un radical arilo o heteroarilo de 5 o 6 miembros, al menos monosustituido, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclico opcionalmente al menos monosustituido,

25 preferiblemente representa H, un radical alquilo C₁₋₄ lineal o ramificado, ciclohexilo o un radical fenilo,

más preferiblemente H, CH₃, C₂H₅ o fenilo,

30 y R^{1a}-R^{11a}, R^{13a}-R^{18a} y W^a tienen la significación indicada anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, sus racematos o en forma de una mezcla de al

menos dos de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, en cualquier relación de mezcla, o sus sales correspondientes, o solvatos correspondientes.

- 5 También preferido es el uso de compuestos de fórmula general (Ia), en la cual R^{13a} y R^{14a} son cada uno independientemente seleccionados del grupo consistente en hidrógeno, un radical alifático C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado, un radical cicloalifático C_{3-C₈} saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente conteniendo al menos un heteroátomo como miembro del anillo, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno C_{1-C₆} opcionalmente al menos monosustituido, y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido, o un radical arilo o heteroarilo de 5 o 6 miembros, al menos monosustituido, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclico opcionalmente al menos monosustituido,
- 10 preferiblemente son cada uno independientemente seleccionados del grupo consistente en H, un radical alquilo C₁₋₄ lineal o ramificado ciclohexilo y un radical fenilo,
- 15 más preferiblemente son cada uno independientemente seleccionados del grupo consistente en H, CH₃, C₂H₅ y fenilo,
- 20 25 y R^{1a}-R^{12a}, R^{15a}-R^{18a} y W^a tienen la significación indicada anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, sus racematos o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, en cualquier relación de mezcla, o sus sales correspondientes, o solvatos correspondientes.

Además, se prefiere el uso de compuestos de fórmula general (Ia), en la cual R^{13a} y R^{14a} junto con el átomo puente de nitrógeno forman un anillo heterocíclico de 5 o 6 miembros saturado, insaturado o aromático, que puede ser al menos monosustituido y/o contener al menos un heteroátomo más como miembro del anillo,

preferiblemente forman un grupo piperidina o morfolina no sustituido,

y R^{1a}-R^{12a}, R^{15a}-R^{18a} y W^a tienen la significación indicada anteriormente, 10 opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, sus racematos o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, en cualquier relación de mezcla, o sus sales correspondientes, o solvatos correspondientes.

15 También preferidos son compuestos de fórmula general (Ia), en la cual R^{15a} representa hidrógeno, un radical alifático C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado, un radical cicloalifático C_{3-C₈} saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente contenido al menos un heteroátomo como miembro del anillo, o un radical arilo o heteroarilo de 5 o 6 miembros, al menos monosustituido, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclico opcionalmente al menos monosustituido,

20 25 preferiblemente representa H, un radical alquilo C₁₋₄ lineal o ramificado, ciclohexilo o un radical fenilo,

más preferiblemente representa H, CH₃, C₂H₅ o fenilo,

y R^{1a}-R^{14a}, R^{16a} a R^{18a} y W^a tienen la significación indicada anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, sus racematos o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, en cualquier relación de mezcla, o sus sales correspondientes, o solvatos correspondientes.

También preferido es el uso de compuestos de fórmula general (la), en la cual R^{16a} representa un radical alifático C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado,

preferiblemente un radical alquilo C₁₋₃ lineal o ramificado, saturado, no sustituido,

más preferiblemente un radical metilo,

y R^{1a}-R^{15a}, R^{17a}, R^{18a} y W^a tienen la significación indicada anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, sus racematos o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, en cualquier relación de mezcla, o sus sales correspondientes, o solvatos correspondientes:

También preferido es el uso de compuestos de fórmula general (la), en la cual R^{17a} representa un radical alifático C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado,

preferiblemente un radical alquilo C₁₋₃ lineal o ramificado, saturado, no sustituido,

más preferiblemente un radical metilo,

y R^{1a}-R^{16a}, R^{18a} y W^a tienen la significación indicada anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, sus racematos o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, en cualquier relación de mezcla, o sus sales correspondientes, o solvatos correspondientes.

Particularmente preferido es el uso de uno o más compuestos sulfonamídicos derivados de benzoxazinona de fórmula general (I) de la lista A mencionada anteriormente,

más particularmente preferido es el uso de uno o más compuestos sulfonamídicos derivados de benzoxazinona de fórmula general (I) seleccionados del grupo consistente en:

1-[1-(Naftil-1-sulfonil)-piperidin-4-il]-1,4-dihidro-benzo[d][1,3]oxazin-2-ona,

1-(1-Fenilsulfonilpiperidin-4-il)-1,4-dihidro-benzo[d][1,3]-oxazin-2-ona,

1-[1-(5-Cloro-3-metil-benzo[b]tiofenil-2-sulfonil)-piperidin-4-il]-1,4-dihidro-benzo[d][1,3]oxazin-2-ona,

8-Metil-1-[1-naftil-1-sulfonil)-piperidin-4-il]-1,4-dihidro-benzo[d][1,3]oxazin-2-ona,

1-[1-(Quinolin-8-sulfonil)-piperidin-4-il]-1,4-dihidro-benzo[d][1,3]oxazin-2-ona,

8-Metil-1-[1-(Quinolin-8-sulfonil)-piperidin-4-il]-1,4-dihidro-benzo[d][1,3]oxazin-2-ona,

1-[1-(5-Dimetilamino-naftil-1-sulfonil)-piperidin-4-il]-8-metil-1,4-dihidrobenzo[d][1,3]oxazin-2-ona,

1-[1-(5-Dimetilamino-naftil-1-sulfonil)-piperidin-4-il]-1,4-dihidro-benzo[d][1,3]oxazin-2-ona,

5 1-[1-(2,3-Dicloro-fenilsulfonil)-piperidin-4-il]-1,4-dihidro-benzo[d][1,3]oxazin-2-ona,

10 1-[1-(2,3-Dicloro-fenilsulfonil)-piperidin-4-il]-8-metil-1,4-dihidro-benzo[d][1,3]oxazin-2-ona, y

10 sus sales correspondientes, o sus solvatos correspondientes.

Los compuestos de fórmula general (Ia), sus estereoisómeros, sales correspondientes y disolventes correspondientes pueden obtenerse

15 análogamente con los métodos descritos anteriormente para compuestos de fórmula general (I).

El medicamento según la presente invención puede estar en cualquier forma adecuada para su aplicación a humanos y/o animales, particularmente mamíferos, incluido el hombre, y puede obtenerse mediante procedimientos convencionales conocidos en el estado de la técnica. La composición del medicamento puede variar en función de la vía de administración.

La preparación de las composiciones farmacéuticas correspondientes así como de los medicamentos formulados puede efectuarse mediante métodos convencionales conocidos en el arte de la técnica, por ej. a partir de los índices de "Pharmaceutics: The Science of Dosage Forms", Second Edition, Aulton, M.E. (ED. Churchill Livingstone, Edinburgh (2002); "Encyclopedia of Pharmaceutical Technology", Second Edition, Swarbrick, J. and Boylan J.C. (Eds.), Marcel Dekker, Inc. New York (2002); "Modern Pharmaceutics", Fourth Edition, Banker G.S. and Rhodes C.T. (Eds.) Marcel Dekker, Inc. New York 2002 y "The Theory and Practice of Industrial Pharmacy", Lachman L.,

Lieberman H. And Kanig J. (Eds.), Lea & Febiger, Philadelphia (1986). Las respectivas descripciones bibliográficas se incorporan como referencia y son parte de esta revelación.

- 5 Las composiciones farmacéuticas, así como los medicamentos formulados preparados según la presente invención, pueden, además de al menos un compuesto de fórmula general (I) o (Ia), opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, su racemato o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros,
- 10 preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, en cualquier relación de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable correspondiente o un solvato correspondiente, comprender otras sustancias auxiliares convencionales conocidas en el arte de la técnica, como excipientes, rellenos, disolventes, diluyentes, agentes colorantes, agentes de recubrimiento, agentes matriciales y/o aglutinantes. Como también
- 15 saben los expertos en el arte de la técnica, la elección de las sustancias auxiliares y las cantidades de los mismos dependen de la vía de administración pretendida, por ej. rectal, intravenosa; intraperitoneal, intramuscular, intranasal, bucal o tópica.
- 20 Medicamentos adecuados para administración oral son, por ejemplo, comprimidos, grageas, cápsulas o multiparticulados, como gránulos o pellets, opcionalmente sometidos a compresión en comprimidos, llenados en cápsulas o suspendidos en soluciones, suspensiones o líquidos adecuados.
- 25 Medicamentos adecuados para administración parenteral, tópica o inhalatoria pueden seleccionarse preferiblemente de un grupo consistente en soluciones, suspensiones, preparaciones secas rápidamente reconstituibles y también preparaciones para pulverización.
- 30 Medicamentos adecuados, por ej. para uso oral o percutáneo pueden liberar los compuestos de fórmula general (I) de forma retardada, siendo la preparación de

estos medicamentos de liberación retardada generalmente conocidos en el arte de la técnica.

Las formas adecuadas de liberación retardada, así como los materiales y métodos para su preparación, son conocidos en el arte de la técnica, por ej. a partir de los índices de "Modified-Release Drug Delivery Technology", Rathbone, M.J. Hadgraft, J. and Roberts, M.S. (Eds.), Marcel Dekker, Inc., New York (2002); "Handbook of Pharmaceutical Controlled Release Technology", Wise, D.L. (Ed.), Marcel Dekker, Inc. New York, (2000); "Controlled Drug Delivery", Vol. I, Basic Concepts, Bruck, S.D. (Ed.), CRD Press Inc., Boca Raton (1983) y de Takada, K. and Yoshikawa, H., "Oral Drug Delivery", Encyclopedia of Controlled Drug Delivery, Mathiowitz, E. (Ed.), John Wiley & Sons, Inc., New York (1999), Vol. 2, 728-742; Fix, J., "Oral drug delivery, small intestine and colon", Encyclopedia of Controlled Drug Delivery, Mathiowitz, E. (Ed.), John Wiley & Sons, Inc., New York (1999), Vol. 2, 698-728. Las descripciones bibliográficas respectivas se incorporan por referencia y forman parte de la revelación.

El medicamento de la presente invención también puede tener al menos un recubrimiento entérico que se disuelve en función del pH. Gracias a este recubrimiento, el medicamento puede pasar sin disolver por el estómago y los compuestos de la fórmula general I sólo se liberan en el tracto intestinal. El recubrimiento entérico se disuelve preferiblemente a un pH de entre 5 y 7,5. Los materiales y métodos adecuados para la preparación de recubrimientos entéricos también son conocidos en el arte de la técnica.

Los compuestos de la presente invención también pueden administrarse tópicamente o mediante suppositorio.

Las composiciones antes mencionadas incluyen preferiblemente 1 a 60 % en peso de uno o más de los compuestos sulfonamídicos derivados de benzoxazinona de fórmulas generales (I) o (Ia), opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, su racemato o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros, en

cualquier relación de mezcla, o una de sus sales fisiológicamente aceptables, o un solvato, respectivamente, y 40 a 99 % por peso del (los) vehículo(s) farmacéutico(s) apropiado(s).

- 5 La dosificación diaria para humanos y animales puede variar dependiendo de factores basados en las respectivas especies o en otros factores, como edad, sexo, peso, grado de enfermedad, etc. La dosificación diaria en el hombre suele oscilar entre 1 y 2000 miligramos, preferiblemente entre 1 y 1500 mg, más preferiblemente entre 1 y 1000 mg de sustancia administrada en una o varias tomas.
- 10

Métodos farmacológicos:**BINDING AL RECEPTOR DE SEROTONINA 5HT₆**

5 Membranas celulares de células HEK-293 que expresan el receptor recombinante humano 5HT₆ fueron suministradas por Receptor Biology. En dichas membranas la concentración de receptor es de 2,18 pmol/mg proteína y la concentración de proteína es de 9,17 mg/ml. El protocolo experimental sigue el método de B. L. Roth y col [B. L. Roth, S. C. Craig, M. S. Choudhary, A. Uluer, F. J. Monsma, Y. Shen, H. Y. Meltzer, D. R. Sibley: Binding of Typical and Atypical Antipsychotic Agents to 5-Hydroxytryptamine-6 and Hydroxytryptamine-7 Receptors. *The Journal of Pharmacology and Experimental Therapeutics*, 1994, 268, 1403] con las siguientes ligeras modificaciones. La parte respectiva de la descripción bibliográfica se incorpora aquí como referencia y forma parte de la divulgación. La membrana comercial se diluye (dilución 1:40) con el tampón de binding: 50 mM Tris-HCl, 10 mM MgCl₂, 0,5 mM EDTA (pH 7,4). El radioligando utilizado es: [³H]-LSD a una concentración de 2,7 nM siendo el volumen final de 200 µl. La incubación se inicia por la adición de 100 µl de la suspensión de membrana, (\approx 22,9 µg proteína de membrana), y se prolonga durante 60 minutos a una temperatura de 37°C. La incubación se termina por la filtración rápida en un Harvester Brandel Cell a través de filtros de fibra de vidrio de la marca Schleicher & Schuell GF 3362 pretratados con una solución de polietilenimina al 0,5 %. Los filtros se lavan tres veces con tres mililitros de tampón Tris-HCl 50 mM pH 7,4.

10 20 25 30

Los filtros son transferidos a viales y se añade a cada vial 5 ml de cocktail de centelleo líquido Ecoscint H. Los viales se dejan equilibrar durante varias horas antes de proceder a su contaje en un contador de centelleo Wallac Winspectral 1414. El binding no específico se determina en presencia de 100 µM de serotonina. Los ensayos se realizan por triplicado. Las constantes de inhibición (K_i, nM) se calculan por análisis de regresión no lineal utilizando el programa EBDA/LIGAND [Munson and Rodbard, *Analytical Biochemistry*, 1980, 107, 220], que se incorpora aquí como referencia y forma parte de la divulgación.

MEDICIONES DE INGESTA DE ALIMENTOS (MODELOS DE COMPORTAMIENTO)

5 Se utilizan ratas W macho (200-270g), de Harlan, S.A. Las ratas se aclimatan al estabulario durante al menos 5 días antes de someterse a cualquier experimento. Durante este periodo, los animales son alojados (por grupos de cinco) en jaulas translúcidas con agua y comida ad libitum. Al menos 24 horas antes de las pruebas, los animales son adaptados a condiciones de
10 alojamiento individual.

El efecto agudo de los derivados sulfonamídicos de fórmula general (I) usados inventivamente sobre la ingestión alimenticia en ratas en ayunas se determina como sigue:

15 Las ratas se mantienen en ayunas durante 23 horas en sus jaulas individuales de origen. Tras este periodo, las ratas se tratan oral o intraperitonealmente con una composición que comprende un derivado sulfonamídico de fórmula general (I) o una composición correspondiente (vehículo) sin dicho derivado
20 sulfonamídico. Inmediatamente después, se deja a la rata con comida prepesada se mide la ingestión alimenticia acumulada al cabo de 1, 2, 4 y 6 horas.

Dicho método de medición de la ingestión alimenticia también está descrito en
25 la literatura (Kask et al., *European Journal of Pharmacology* 414 (2001), 215-224 y Turnbull et al., *Diabetes*, Vol. 51, August 2002). Las respectivas partes de las descripciones se incorporan aquí como referencia y forman parte de la divulgación.

30 La presente invención se ilustra a continuación con ejemplos. Estos ejemplos se dan exclusivamente a título ilustrativo y no limitan el espíritu general de la presente invención.

Ejemplos:

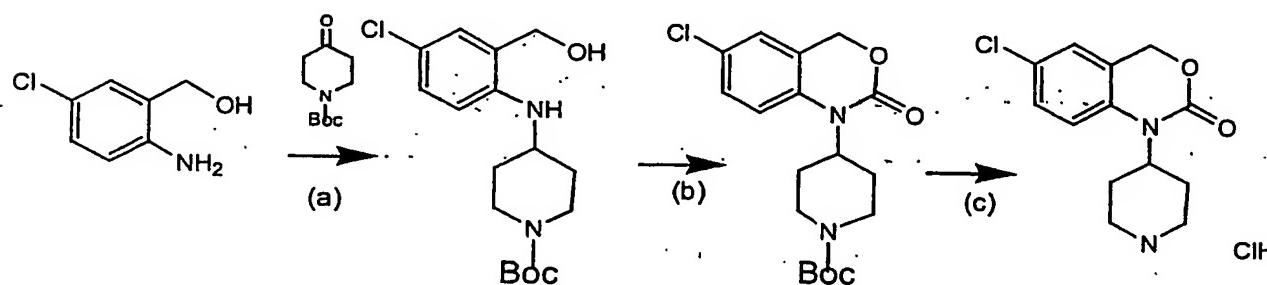
5 Los compuestos intermedios de fórmulas generales (II) y (III) se prepararon con métodos químicos orgánicos convencionales conocidos en el estado de la técnica. El siguiente ejemplo A muestra la preparación de un compuesto intermedio de fórmula general (II):

Ejemplo A:

10

Síntesis de un compuesto intermedio de fórmula general (II)

Preparación de clorhidrato de 6-Cloro-1-(piperidin-4-il)-1,4-dihidro-2H-3,1-benzoxazin-2-ona



15

a) 1-(tert-Butiloxicarbonil)-4-[4-cloró-(2-hidroximetilfenilamino)]piperidina

Una disolución de 1-(tert-butiloxicarbonil)-4-piperidinona (20 g, 0.10 mol), alcohol 2-amino-5-clorobenzílico (17.34 g, 0.11 mol) y ácido acético (14 mL, 0.22 mol) en tolueno seco (500 mL) se calentó a la temperatura de refluxo, 20 eliminando el agua mediante destilación del azeótropo con un Dean-Stark, durante 6 horas. A continuación, la mezcla se enfrió y se concentró al vacío hasta la mitad de volumen. A la disolución resultante se adicionó NaBH₃CN (20 g, 0.32 mol) y THF seco (300 mL). Seguidamente, se adicionó gota a gota durante una hora ácido acético (10 mL, 0.17 mol). La reacción se agitó a 25 temperatura ambiente durante 24 horas. La mezcla se concentró al vacío y el residuo se disolvió en acetato de etilo (750 mL), se lavó con una disolución

saturada da NaHCO_3 (4 x 250 mL) y con una disolución saturada de NaCl (250 mL), se secó y evaporó a sequedad. El residuo se purificó mediante cromatografía flash eluyendo con una mezcla de acetato de etilo: éter de petróleo (1:3). De esta forma se obtuvo el producto deseado como un aceite (32.7 g, 96%).

^1H RMN (CDCl_3): 1.32 (d, $J = 11.2$ Hz, 2H), 1.41(s, 9H), 1.92 (d, $J = 11.2$ Hz, 2H), 2.92 (t, $J = 12.0$ Hz, 1H), 3.10 (s, 1H), 3.37 (m, 1H), 3.88 (d, $J = 13.7$ Hz, 2H), 4.49 (s, 2H), 4.75 (s, 1H), 6.52 (d, $J = 8.6$ Hz, 1H), 6.96 (s, 1H), 7.07 (d, $J = 8.6$ Hz, 1H).

10

b) **1-(1-*tert*-Butiloxicarbonil-4-piperidinil)-6-cloro-1,4-dihidro-2*H*-3,1-benzoxazin-2-ona**

A una disolución de 1-(*tert*-Butiloxicarbonil)-4-[(4-cloro-(2-hidroximetil)fenil-amino)piperidina (27.0 g, 79 mmol) en THF seco (250 mL) enfriada a 0 °C, se adicionó *N,N*-diisopropiletilamina (DIEA) (43 mL, 0.25 mol) y trifosgeno (8.65 g, 29.2 mmol). La reacción se mantuvo en agitación a 0 °C durante 1 h y a temperatura ambiente durante 72 h. Se añadió éter etílico y la mezcla se enfrió a 0 °C durante 3 h y a continuación se filtró el clorhidrato de la DIEA. La disolución filtrada se evaporó a sequedad y el residuo se disolvió en acetato de etilo (750 mL), se lavó con una disolución al 5% de ácido cítrico (2 x 500 mL), agua (250 mL) y disolución saturada de NaHCO_3 (2 x 500 mL). La disolución de acetato de etilo se secó (MgSO_4), filtró y evaporó a presión reducida. El residuo se llevó a ebullición con éter etílico hasta que todo el sólido se disolvió y se enfrió durante una noche para proporcionar el compuesto deseado en forma cristalina (28.9 g, 67%).

Punto de fusión: 177-179 °C

^1H RMN (CDCl_3): 1.46 (s, 9H), 1.79 (d, $J = 10.1$ Hz, 1H), 2.54 (m, 2H), 2.78 (m, 2H), 3.96 (m, 1H), 4.28 (m, 2H), 5.02 (s, 2H), 6.98 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.13 (d, $J = 2.4$ Hz, 1H), 7.28 (dd, $J = 8.7$ Hz, $J = 2.4$ Hz, 1H). °

30

c) **6-Cloro-1-(piperidin-4-il)-1,4-dihidro-2*H*-3,1-benzoxazin-2-ona clorhidrato**

Una disolución de 1-[(1-tert-Butiloxicarbonil)-4-piperidinil]-6-cloro-1,4-dihidro-2H-3,1-benzoxazin-2-ona (24 g, 65 mmol) en acetato de etilo (500 mL) se enfrió a 0 °C. A continuación se adicionó una disolución 5 M de cloruro de hidrógeno en éter etílico (500 mL) y la mezcla resultante se mantuvo en agitación 4 h a 0 °C. El precipitado formado se recogió por filtración, se lavó con éter y se secó al vacío para dar el producto deseado como un sólido (16.95 g, 97%).

Punto de fusión: 254-257 °C

¹H RMN (CD₃OD): 2.13 (d, *J* = 12.2 Hz, 2H), 2.88 (m, 2H), 3.20 (m, 2H), 3.53 (d, *J* = 12.8 Hz, 2H), 4.24 (m, 1H), 5.16 (s, 2H), 7.31 (m, 2H), 7.41 (dd, *J* = 8.8 Hz, *J* = 2.6 Hz, 1H).

Varios compuestos sustituidos 3,1-benzoxacin-2-ona se han preparado mediante sus respectivos alcoholes benzílicos sustituidos obtenidos por reducción de los correspondientes ácidos antranílicos con hidruro de litio y aluminio y otros agentes reductores conocidos y empleados en el estado de la técnica (ver esquema 2), como por ejemplo 6-metil-1-(piperidin-4-il)-1,4-dihidro-2H-3,1-benzoxazin-2-ona, 7-metil-1-(piperidin-4-il)-1,4-dihidro-2H-3,1-benzoxazin-2-ona, 8-metil-1-(piperidin-4-il)-1,4-dihidro-2H-3,1-benzoxazin-2-ona , 5-metoxi-1-(piperidin-4-il)-1,4-dihidro-2H-3,1-benzoxazin-2-ona, 6-fluoro-1-(piperidin-4-il)-1,4-dihidro-2H-3,1-benzoxazin-2-ona, 8-metoxi-1-(piperidinil)-1,4-dihidro-2H-3,1-benzoxazin-2-ona, 5-metil-1-(piperidin-4-il)-1,4-dihidro-2H-3,1-benzoxazin-2-ona, 7-fluoro-1-(piperidin-4-il)-1,4-dihidro-2H-3,1-benzoxazin-2-ona, 5-fluoro-1-(piperidin-4-il)-1,4-dihidro-2H-3,1-benzoxazin-2-ona, 6-metoxi-1-(piperidinil)-1,4-dihidro-2H-3,1-benzoxazin-2-ona, 5-cloro-1-(piperidinil)-1,4-dihidro-2H-3,1-benzoxazin-2-ona, 7-cloro-1-(piperidinil)-1,4-dihidro-2H-3,1-benzoxazin-2-ona, 8-cloro-1-(piperidinil)-1,4-dihidro-2H-3,1-benzoxazin-2-ona,

y otras. La desprotección de los correspondientes 5-metoxi-1-(piperidinil)-1,4-dihidro-2H-3,1-benzoxazin-2-ona y 8-metoxi-1-(piperidinil)-1,4-dihidro-2H-3,1-benzoxazin-2-ona,6-metoxi-1-(piperidinil)-1,4-dihidro-2H-3,1-benzoxazin-2-ona mediante métodos convencionales tales como BBr₃ en un disolvente

orgánico inerte conduce a los correspondientes derivados 5-hidroxi-1-(piperidinil)-1,4-dihidro-2H-3,1-benzoxazin-2-ona y 8-hidroxi-1-(piperidinil)-1,4-dihidro-2H-3,1-benzoxazin-2-ona, 6-hidroxi-1-(piperidinil)-1,4-dihidro-2H-3,1-benzoxazin-2-ona. La benzoxazin-2-ona sin sustituir, 1-(piperidin-4-il)-1,4-dihidro-2H-3,1-benzoxazin-2-ona, se preparó de acuerdo con el procedimiento descrito en la literatura (*J. Med. Chem.* 1995, 38, 4634) y (*J. Med. Chem.* 1998, 41, 2146), estas referencias se incorporan aquí y forman parte de su divulgación.

10

La reducción de los ácidos antranílicos sustituidos se efectuó por métodos convencionales conocidos en el estado de la técnica., ej. empleando LiAlH₄ como agente reductor, en THF anhidro y en atmósfera inerte, ej. argón o nitrógeno El proceso es muy eficiente y se obtienen en la mayoría de los casos los correspondientes 2-aminobenzilalcoholes con buenos rendimientos.

15

Método general para la reducción de ácidos antranílicos sustituidos:

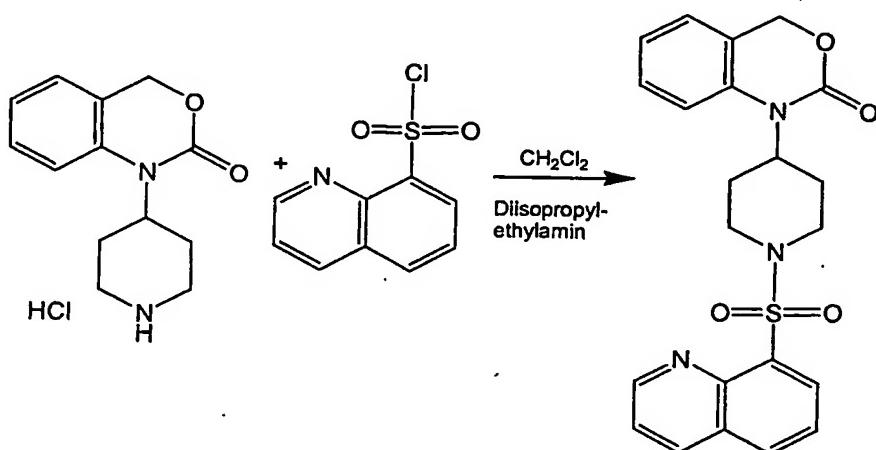
En un matraz de tres bocas equipado con agitador mecánico y una entrada de gas nitrógeno, se introducen 100 ml. de THF anhidro y 116,6 mmoles de hidruro de litio y aluminio y la suspensión resultante se enfriá a 0 °C. A continuación se adiciona 58,3 mmoles del correspondiente ácido antranílico sustituido en 150 ml de THF anhidro, la mezcla de reacción se calienta hasta temperatura ambiente y se agita durante una hora. Se enfriá la mezcla a 0 °C y se adiciona con precaución 4,7 ml de agua, 4,7 ml de NaOH 15% y finalmente 14 ml de agua. Se filtra la suspensión resultante y se lava el insoluble con acetato de etilo.

La fase orgánica se lava con agua, seca y evapora. En algunos casos el producto resultante puede emplearse sin posterior purificación.

30

Ejemplo 5:**Preparación de 1-[1-Quinolin-8-sulfonil]-piperidin-4-il]-1,4-dihidrobenzo[d][1,3]oxazin-2-ona**

5



150 mg (0,66 mmol) de cloruro de quinolin-8-sulfonilo se añaden a una mezcla de clorhidrato de 1-(4-piperidinil)-1,4-dihidro-2H-3,1-benzoxazinona (161 mg, 0,60 mmol) y diisopropiletilamina (230 mg, 1,80 mmol) en diclorometano (10 ml) y la mezcla resultante se agita durante toda la noche a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se lava con agua (3 x 15 mL) y la fase orgánica se separa, se seca y se evapora a sequedad. Se obtiene un sólido, que se recristaliza de etanol. Se obtienen 182 mg de 1-[1-quinolin-8-sulfonil]-piperidin-4-il]-1,4-dihidrobenzo[d][1,3]oxazin-2-ona como sólido blanco (rendimiento 69 %).

IR (cm^{-1}) KBr: 1712, 1337, 1291, 1205, 1162, 1144, 1034, 717, 583

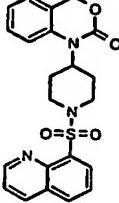
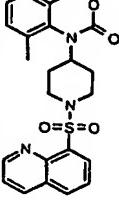
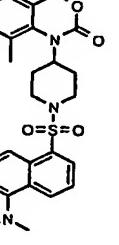
^1H -RMN(δ in ppm): 1.8 (d, $J=9.5$ Hz, 2 H) 2.6 (qd, $J=12.6$, 4.4 Hz, 2 H) 3.0 (td, $J=12.8$, 2.5 Hz, 2 H) 4.1 (tt, $J=12.5$, 3.8 Hz, 1 H) 4.3 (ddd, $J=13.0$, 2.3 Hz, 2 H) 5.0 (s, 2 H) 7.1 (m, 3 H) 7.3 (m, 1 H) 7.6 (dd, $J=8.4$, 4.2 Hz, 1 H) 7.6 (m, 1 H) 8.1 (dd, $J=8.2$, 1.3 Hz, 1 H) 8.3 (dd, $J=8.3$, 1.7 Hz, 1 H) 8.5 (dd, $J=7.3$, 1.5 Hz, 1 H) 9.1 (dd, $J=4.2$, 1.8 Hz, 1 H) (CDCl_3 -d).

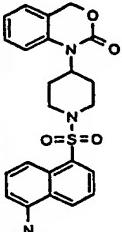
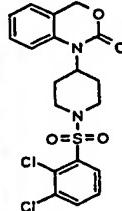
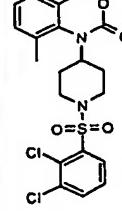
Punto de fusión: 170-172 °C.

Los compuestos según los ejemplos 1-4 y 6-10 facilitados en la siguiente tabla I se prepararon de forma análoga a los métodos descritos anteriormente.

Tabla 1:

	1-[1-(Naftil-1-sulfonil)-piperidin-4-il] -1,4-dihidro-benzo[d][1,3]oxazina-2-oná	
Ej. 1	<p>1H-RMN: 1.8 (d, $J=10.5$ Hz, 2 H) 2.4 (m, 2 H) 2.7 (t, $J=11.6$ Hz, 2 H) 3.9 (m, 3 H) 5.1 (s, 2 H) 7.1 (m, 2 H) 7.2 (m, 2 H) 7.7 (m, 3 H) 8.1 (d, $J=8.1$ Hz, 1 H) 8.2 (d, $J=7.8$ Hz, 1 H) 8.3 (d, $J=8.1$ Hz, 1 H) 8.7 (d, $J=8.3$ Hz, 1 H) (DMSO-d6)</p> <p>IR (KBr) 1709, 1498, 1353, 1162, 1034, 770, 718, 579</p> <p>Punto de fusión: 147-149°C</p>	
Ej. 2	<p>1H-RMN: 1.9 (dd, $J=12.1, 2.1$ Hz, 2 H) 2.4 (td, $J=12.2, 2.4$ Hz, 2 H) 2.7 (qd, $J=12.6, 4.3$ Hz, 2 H) 3.9 (tt, $J=12.3, 3.9$ Hz, 1 H) 4.0 (dt, $J=11.9, 2.1$ Hz, 2 H) 5.0 (s, 2 H) 7.0 (d, $J=8.3$ Hz, 1 H) 7.0 (t, $J=7.3$ Hz, 1 H) 7.1 (m, 1 H) 7.3 (m, 1 H) 7.6 (m, 3 H) 7.8 (m, 2 H) (CDCl₃-d)</p> <p>IR (KBr) 1705, 1497, 1340, 1293, 1205, 1160, 736, 691, 576</p> <p>Punto de fusión: 172-174°C</p>	
Ej. 3	<p>1H-RMN: 1.8 (d, $J=10.8$ Hz, 2 H) 2.5 (m, 2 H) 2.7 (s, 3 H) 2.8 (t, $J=11.4$ Hz, 2 H) 3.8 (d, $J=11.4$ Hz, 2 H) 3.9 (m, 1 H) 5.1 (s, 2 H) 7.0 (t, $J=7.2$ Hz, 1 H) 7.2 (d, $J=8.1$ Hz, 1 H) 7.2 (m, 2 H) 7.6 (dd, $J=8.6, 2.0$ Hz, 1 H) 8.1 (d, $J=2.0$ Hz, 1 H) 8.2 (d, $J=8.6$ Hz, 1 H) (DMSO-d6)</p> <p>IR (KBr) 1717, 1358, 1248, 1201, 1160, 1035, 712, 554</p> <p>Punto de fusión: 204-206°C</p>	
Ej. 4	<p>1H-RMN: 1.9 (d, $J=12.5$ Hz, 2 H) 2.3 (s, 3 H) 2.7 (m, 4 H) 3.3 (m, 1 H) 4.0 (d, $J=11.2$ Hz, 2 H) 4.9 (s, 2 H) 7.0 (m, 2 H) 7.1 (d, $J=7.0$ Hz, 1 H) 7.6 (m, 3 H) 7.9 (m, 1 H) 8.1 (d, $J=8.2$ Hz, 1 H) 8.2 (dd, $J=7.3, 1.1$ Hz, 1 H) 8.7 (d, $J=8.8$ Hz, 1 H) (CDCl₃-d)</p> <p>IR (KBr) 1712, 1316, 1279, 1222, 1160, 1135, 1025, 768, 607</p> <p>Punto de fusión: 203-204°C</p>	

	1-[1-(Quinolinil-8-sulfonil)-piperidin-4-il]-1,4-dihidro-benzo[d][1,3]oxazina-2-ona
Ej. 5	<p></p> <p>1H-RMN: 1.8 (d, $J=9.5$ Hz, 2 H) 2.6 (qd, $J=12.6, 4.4$ Hz, 2 H) 3.0 (td, $J=12.8, 2.5$ Hz, 2 H) 4.1 (tt, $J=12.5, 3.8$ Hz, 1 H) 4.3 (ddd, $J=13.0, 2.3$ Hz, 2 H) 5.0 (s, 2 H) 7.1 (m, 3 H) 7.3 (m, 1 H) 7.6 (dd, $J=8.4, 4.2$ Hz, 1 H) 7.6 (m, 1 H) 8.1 (dd, $J=8.2, 1.3$ Hz, 1 H) 8.3 (dd, $J=8.3, 1.7$ Hz, 1 H) 8.5 (dd, $J=7.3, 1.5$ Hz, 1 H) 9.1 (dd, $J=4.2, 1.8$ Hz, 1 H) (CDCl₃-d)</p> <p>IR (KBr) 1712, 1337, 1291, 1205, 1162, 1144, 1034, 717, 583</p> <p>Punto de fusión: 170-172°C</p>
	8-Metil-1-[1-(quinolinil-8-sulfonil)-piperidin-4-il]-1,4-dihidro-benzo[d][1,3]oxazina-2-ona
Ej. 6	<p></p> <p>1H-RMN: 1.9 (d, $J=12.6$ Hz, 2 H) 2.3 (s, 3 H) 2.7 (qd, $J=12.2, 3.9$ Hz, 2 H) 2.9 (m, 2 H) 3.3 (tt, $J=11.7, 3.4$ Hz, 1 H) 4.3 (d, $J=12.8$ Hz, 2 H) 4.9 (s, 2 H) 7.0 (m, 2 H) 7.1 (d, $J=7.3$ Hz, 1 H) 7.5 (dd, $J=8.3, 4.1$ Hz, 1 H) 7.6 (m, 1 H) 8.0 (dd, $J=8.2, 1.3$ Hz, 1 H) 8.2 (dd, $J=8.3, 1.7$ Hz, 1 H) 8.5 (dd, $J=7.3, 1.5$ Hz, 1 H) 9.1 (dd, $J=4.2, 1.8$ Hz, 1 H) (CDCl₃-d)</p> <p>IR (KBr) 1702, 1329, 1284, 1218, 1024, 785, 701, 582</p> <p>Punto de fusión: 202-206°C</p>
	1-[1-(5-Dimetilamino-naftil-1-sulfonil)-piperidin-4-il]-8-Metilo -1,4-dihidro-benzo[d][1,3]oxazina-2-ona
Ej. 7	<p></p> <p>1H-RMN: 1.9 (d, $J=11.9$ Hz, 2 H) 2.3 (s, 3 H) 2.7 (m, 4 H) 2.9 (s, 6 H) 3.3 (m, 1 H) 4.0 (d, $J=9.9$ Hz, 2 H) 4.9 (s, 2 H) 7.0 (m, 2 H) 7.2 (m, $J=7.3$ Hz, 2 H) 7.5 (m, 2 H) 8.2 (dd, $J=7.3, 1.1$ Hz, 1 H) 8.4 (d, $J=8.6$ Hz, 1 H) 8.6 (d, $J=8.4$ Hz, 1 H) (CDCl₃-d)</p> <p>IR (KBr) 2981, 1711, 1336, 1221, 1149, 1025, 794, 709, 571</p> <p>Punto de fusión: 202-203°C</p>

	1-[1-(5-Dimetilamino-naftil-1-sulfoni)-piperidin-4-il]-1,4-dihidro-benzo[d][1,3]oxazina-2-ona
Ej. 8	 <p>1H-RMN: 1.8 (dd, $J=12.3, 3.5$ Hz, 2 H) 2.7 (m, 4 H) 2.9 (s, 6 H) 4.0 (m, 3 H) 5.0 (s, 2 H) 6.9 (d, $J=8.2$ Hz, 1 H) 7.1 (m, 2 H) 7.3 (m, 2 H) 7.6 (td, $J=8.9, 7.4$ Hz, 2 H) 8.3 (dd, $J=7.3, 1.3$ Hz, 1 H) 8.4 (d, $J=8.8$ Hz, 1 H) 8.6 (d, $J=8.2$ Hz, 1 H) (CDCl₃-d)</p> <p>IR (KBr) 2935, 1720, 1319, 1242, 1144, 920, 791, 755, 642</p> <p>Punto de fusión: 182-186°C</p>
Ej. 9	<p>1-[1-(2,3-Dicloro-fenilsulfoni)-piperidin-4-il]-1,4-dihidro-benzo[d][1,3]oxazina-2-ona</p>  <p>1H-RMN: 1.9 (d, $J=10.1$ Hz, 2 H) 2.7 (qd, $J=12.6, 4.2$ Hz, 2 H) 3.0 (td, $J=12.7, 2.3$ Hz, 2 H) 4.1 (m, 3 H) 5.1 (s, 2 H) 7.1 (m, 3 H) 7.3 (m, 2 H) 7.7 (dd, $J=8.0, 1.6$ Hz, 1 H) 8.0 (dd, $J=8.0, 1.6$ Hz, 1 H) (CDCl₃-d)</p> <p>IR (KBr) 1697, 1395, 1244, 1165, 1045, 942, 710, 582</p> <p>Punto de fusión: 185-187°C</p>
Ej. 10	<p>1-[1-(2,3-Dicloro-fenilsulfoni)-piperidin-4-il]-8-Metil-1,4-dihidro-benzo[d][1,3]oxazina-2-ona</p>  <p>1H-RMN: 2.0 (d, $J=11.5$ Hz, 2 H) 2.4 (s, 3 H) 2.8 (m, 4 H) 3.4 (m, 1 H) 4.0 (d, $J=9.9$ Hz, 2 H) 5.0 (s, 2 H) 7.0 (m, 2 H) 7.2 (d, $J=7.7$ Hz, 1 H) 7.3 (t, $J=8.0$ Hz, 1 H) 7.7 (dd, $J=8.1, 1.5$ Hz, 1 H) 8.0 (dd, $J=8.0, 1.6$ Hz, 1 H) (CDCl₃-d)</p> <p>IR (KBr) 1705, 1404, 1339, 1224, 1149, 939</p> <p>Punto de fusión: 184-185°C</p>

Datos farmacológicos:

El binding de los compuestos sulfonamídicos derivados de benzoxazinona de fórmulas generales (I) y (Ia) se determinó como se ha descrito anteriormente.

5

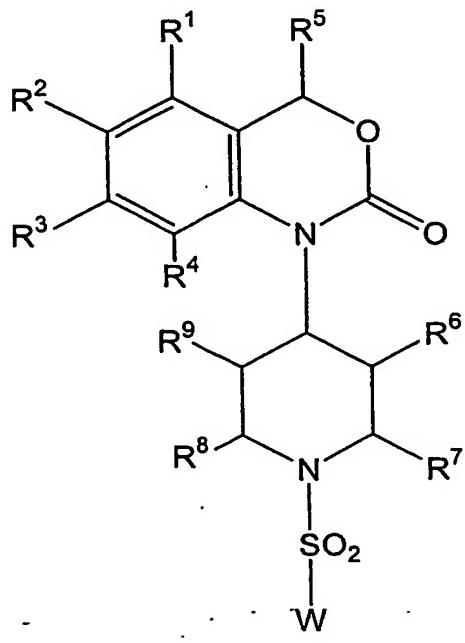
Los resultados de binding de algunos de estos compuestos se muestran en la siguiente tabla 2:

Tabla 2:		
Compuesto según el ejemplo:	% Inhibición 10^{-6} M	K_i (nM)
1	98.1 ± 4.0	51.7
3		107.4
4		246
5		152
6		165.9
7	88	
8	68	

10

Reivindicaciones:

1. Compuestos sulfonamídicos derivados de benzoxazinona de fórmula general (I)



5

(I),

en la cual

- 10 R¹, R², R³, R⁴ son cada uno seleccionados independientemente del grupo consistente en hidrógeno, halógeno, un radical alifático, lineal o ramificado, saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, un radical cicloalifático saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente contenido al menos un heteroátomo como miembro del anillo, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno opcionalmente al menos monosustituido, y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido, o un radical arilo o heteroarilo opcionalmente al menos monosustituido, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno opcionalmente al menos monosustituido y/o puede
- 15
- 20

condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido, un grupo nítrro, ciano, -OR¹⁰, -O(C=O)R¹¹, -(C=O)OR¹¹, -SR¹², -SOR¹², -SO₂R¹², -NH-SO₂R¹², -SO₂NH₂ y -NR¹³R¹⁴,

5

R⁵ representa hidrógeno, un radical alifático opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado o un radical cicloalifático saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente conteniendo al menos un heteroátomo como miembro del anillo,

10

R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ son cada uno seleccionados independientemente del grupo consistente en hidrógeno, un radical alifático opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado, un radical cicloalifático saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente conteniendo al menos un heteroátomo como miembro del anillo, un grupo ciano y un grupo -COOR¹⁵,

15

W representa un radical alifático opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado, un radical cicloalifático saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente conteniendo al menos un heteroátomo como miembro del anillo, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno opcionalmente al menos monosustituido, y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido,

25

un radical heteroarilo opcionalmente al menos monosustituido, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno opcionalmente monosustituido y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclico opcionalmente al menos monosustituido, un radical arilo monocíclico, opcionalmente al menos monosustituido, que se condensa con un

30

sistema de anillos mono o policíclico opcionalmente al menos monosustituido y que puede enlazarse vía un grupo alquíleno opcionalmente al menos monosustituido,

5 un grupo NR¹⁶R¹⁷,

10 un grupo COR¹⁸,

o un radical fenilo, que es al menos monosustituido por uno de los sustituyentes seleccionados del grupo consistente en:

15 2,2,2,-Trifluoroetoxi-, C₂₋₆-Alquenil-, 1,3-Dihidro-1-oxo-2H-isoindol-2-il-, N-Ftalimidinil-, [(2-cloro-1,3-tiazol-5-il)-metoxi, 5-Etil-2-metil-3-furoato, C₁₁₋₂₀-alquilo, 1,3-Dioxo-2-azaspiro[4,4]non-2-il-, pirazolilo, (1,3-oxazol-5-il)-, (5-Metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-, difluorometoxi, diclorometoxi, 1-pirrolidinilsulfonilo, morfolinsulfonilo, 2-metil-4-pirimidinilo, un grupo fenoxi, que es al menos monosustituido por C₁₋₅-alcoxi, un grupo fenilo; que es al menos monosustituido por uno de los sustituyentes seleccionados del grupo consistente en

20 nitro, C₁₋₅-alcoxi, F, Cl, Br, alquiloC₁₋₅ al menos parcialmente fluorado, C₁₋₅-alquilo al menos parcialmente clorado, [(2-Cloro-1,3-tiazol-5-il)-metoxi]-, -(C=O)-H y -(C=O)-C₁₋₅-alquilo, un grupo piridinilo, que es al menos monosustituido por C₁₋₅-alcoxi, un grupo piridiniloxi, que es al menos monosustituido por C₁₋₅-alcoxi, un grupo fenoxi, que es al menos disustituido y un grupo piridiniloxi, que es al menos disustituido,

25

con la condición de que W no represente furilo no sustituido, tienilo no sustituido o tienilo sustituido por un sustituyente seleccionado del grupo consistente en C₁₋₅-alcoxicarbonilo, C₁₋₅-alquilocarbonilo, carboxilo y piridilo, pirrolilo no sustituido, naftilo no sustituido, indolilo no sustituido, tetrahidronaftilo no sustituido, piridilo sustituido o no sustituido, pirazinilo

no sustituido, quinolinilo no sustituido, pirrolilo sustituido por C₁₋₅-alquilo, ciclohexilo no sustituido o ciclohexilo sustituido por uno o dos miembros seleccionados del grupo consistente en oxo, hidroxilo, C₁₋₅-alcoxilo, C₁₋₅-alcoxi-carboniloamino-C₁₋₅ alquilo y amino-C₁₋₅ alquilo.

5

R¹⁰ representa hidrógeno, un radical alifático, lineal o ramificado, saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, un radical cicloalifático saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente contenido al menos un heteroátomo como miembro del anillo, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno opcionalmente al menos monosustituido, y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido, o un radical arilo o heteroarilo opcionalmente al menos monosustituido, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno opcionalmente al menos monosustituido y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido.

15

20

25

30

R^{11} representa hidrógeno, un radical alifático, lineal o ramificado, saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, un radical cicloalifático saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente contenido al menos un heteroátomo como miembro del anillo, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno opcionalmente al menos monosustituido, y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido, o un radical arilo o heteroárido opcionalmente al menos monosustituido, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno opcionalmente al menos monosustituido y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido.

R¹² representa un radical alifático, lineal o ramificado, saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, un radical cicloalifático saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente contenido al menos un heteroátomo como miembro del anillo, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno opcionalmente al menos monosustituido, y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido, o un radical arilo o heteroarilo opcionalmente al menos monosustituido, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno opcionalmente al menos monosustituido y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido,

R¹³ y R¹⁴ son cada uno seleccionados independientemente del grupo consistente en hidrógeno, un radical alifático, lineal o ramificado, saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, un radical cicloalifático saturado o insaturado; opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente contenido al menos un heteroátomo como miembro del anillo, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno opcionalmente al menos monosustituido, y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido, o un radical arilo o heteroarilo opcionalmente al menos monosustituido, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno opcionalmente al menos monosustituido y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido,

o bien R¹³ y R¹⁴ junto con el átomo puente de nitrógeno forman un anillo heterocíclico saturado, insaturado o aromático, opcionalmente al menos monosustituido, que puede contener al menos un heteroátomo adicional como miembro del anillo,

R¹⁵ representa hidrógeno, un radical alifático, lineal o ramificado, saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, un radical cicloalifático saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente contenido al menos un heteroátomo como miembro del anillo, o un radical arilo o heteroarilo opcionalmente al menos monosustituido, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno opcionalmente al menos monosustituido y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido,

10

R¹⁶ representa un radical alifático opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado,

15

R¹⁷ representa un radical alifático opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado, y

20

R¹⁸ representa un radical arilo opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, su racemato o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, en cualquier relación de mezcla, o una de sus sales correspondientes, o un solvato correspondiente.

25

2. Compuestos según la reivindicación 1, caracterizados porque R¹, R², R³, R⁴ son cada uno independientemente seleccionados del grupo consistente en H, F, Cl, Br, un radical alifático C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado, un radical cicloalifático C_{3-C8} saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente contenido al menos un heteroátomo como miembro del anillo, que puede enlazarse vía un

- grupo alquíleno C₁-C₆ opcionalmente al menos monosustituido, y/o
puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos
opcionalmente al menos monosustituido, un radical arilo o heteroarilo de
5 o 6 miembros opcionalmente al menos monosustituido, que puede
enlazarse vía un grupo alquíleno C₁₋₆ opcionalmente al menos
monosustituido y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono
o policíclico opcionalmente al menos monosustituido, un grupo nitro,
ciano, -OR¹⁰, -OC(=O)R¹¹, -SR¹², -SOR¹², -SO₂R¹², -NH-SO₂R¹², -
SO₂NH₂ y NR¹³R¹⁴, preferiblemente seleccionados del grupo consistente
10 en H, F, Cl, Br, un radical alifático C₁₋₃ opcionalmente al menos
monosustituido, ramificado o lineal, saturado, un radical cicloalifático C₅
o C₆ saturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente
conteniendo al menos un heteroátomo como miembro del anillo, que
puede enlazarse vía un grupo alquíleno C₁ o C₂ opcionalmente al menos
monosustituido, un grupo nitro, ciano, -OR¹⁰, -OC(=O)R¹¹, -SR¹² y -
15 NR¹³R¹⁴, más preferiblemente seleccionados del grupo consistente en
H, F, Cl, CH₃, CH₂CH₃, CF₃, CF₂CF₃, ciclopentilo, ciclohexilo, nitro, ciano
y -OR¹⁰.
- 20 3. Compuestos según las reivindicaciones 1 o 2, caracterizados porque R⁵
representa hidrógeno, un radical alifático C₁₋₆ opcionalmente al menos
monosustituido, saturado o insaturado; lineal o ramificado, un radical
cicloalifático C₃-C₈ saturado o insaturado, opcionalmente al menos
monosustituido, opcionalmente conteniendo al menos un heteroátomo
25 como miembro del anillo, preferiblemente representa H o un radical
alquilo C₁₋₃ ramificado o lineal, más preferiblemente representa H, CH₃ o
CH₂CH₃.

4. Compuestos según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, caracterizados porque R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ son cada uno independientemente seleccionados del grupo consistente en hidrógeno, un radical alifático C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado, un radical cicloalifático C_{3-C₈} saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente conteniendo al menos un heteroátomo como miembro del anillo, un grupo ciano y un grupo COOR¹⁵, preferiblemente seleccionados del grupo consistente en H, un radical alquilo C₁₋₃ ramificado o lineal, un grupo ciano y un grupo COOR¹⁵, más preferiblemente del grupo consistente en H, CH₃, CH₂CH₃ y un grupo ciano.
5. Compuestos según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, caracterizados porque W representa un radical alquilo C₁₁₋₂₀, lineal o ramificado, opcionalmente al menos monosustituido, un grupo naftilo, que es al menos monosustituido, un grupo quinolinilo, que es al menos monosustituido, un grupo pirrolilo, que es al menos monosustituido por un sustituyente cualquiera excepto por radical alquilo C₁₋₅, un grupo tiazolil-, benzo[b]-tiofenilo, benzo[b]-furanilo, isoquinolinilo, tetrahidroisoquinolinilo, pirazolilo, isoazolilo, cromanilo, benzotiadiazolilo, imidazolilo, benzofurazanilo, dibenzo[b,d]-furanilo, benzoxadiazolilo, imidazo[2,1-b]-tiazolil-, antracenilo, coumarinilo, 2,3-Dihidro-1,4-benzodioxinilo, 2,3-Dihidrobenzo[b]furanilo, 3,4-Dihidro-2H-1,4-benzoxazinilo, 3,4-Dihidro-2H-1,5-benzodioxepinilo, Benzotiazolil-, Imidazo[1,2-a]-piridinilo respectivamente opcionalmente al menos monosustituidos, un grupo cromanilo, un grupo isatinilo, un grupo pentametildihydrobenzofuranilo, un grupo ciclopropil- o ciclopentilo opcionalmente al menos monosustituido, un grupo 2-(1,3-Dioxo-1,3-dihidro-isoindol-2-il)-etilo-, un grupo tienilo, que es al menos monosustituido por uno o más sustituyentes independientemente seleccionados del grupo consistente en F, Cl, Br, C₁₋₅-alcoxi-, CF₃, -SO₂-

C₁₋₅-alquilo y un grupo benzoiloaminometilo, un grupo fenilsulfonilo, un grupo isoxazolilo, un grupo benzoamidometilo, un grupo pirimidilo, un grupo tiazolilo, un grupo pirazolilo, un grupo fenilo, un grupo 1,2,4-tiadiazolilo, un 1,3-oxazolilo y 1,2,4-oxadiazolilo, respectivamente
5 optionalmente al menos monosustituido, un grupo furilo, que es al menos monosustituido por uno o más sustituyentes independientemente seleccionados del grupo consistente en un radical alquilo C₁₋₅, que puede ser al menos parcialmente fluorado o clorado, un fenilo optionalmente al menos monosustituido y un grupo (C=O)-O-C₁₋₅-alquilo,
10
un grupo NR¹⁶R¹⁷,
un grupo COR¹⁸,
15 o un radical fenilo, que es al menos monosustituido por uno de los sustituyentes seleccionados del grupo consistente en:
2,2,2,-Trifluoroetoxi-, C₂₋₆-Alquenil-, 1,3-Dihidro-1-oxo-2H-isoindol-2-il-,
20 N-Ftalimidinil-, [(2-cloro-1,3-tiazol-5-il)-metoxi, 5-Etil-2-metil-3-furoato, C₁₁₋₂₀-alquilo, 1,3-Dioxo-2-azaspiro[4.4]non-2-il-, pirazolilo, (1,3-oxazol-5-il)-, (5-Metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-, difluorometoxi, diclorometoxi, 1-pirrolidinilsulfonilo, morfolinsulfonilo, 2-metil-4-pirimidinilo, un grupo fenoxi, que es al menos monosustituido por C₁₋₅-alcoxi, un grupo fenilo, que es al menos monosustituido por uno de los sustituyentes
25 seleccionados del grupo consistente en nitro, C₁₋₅-alcoxi, F, Cl, Br, alquiloC₁₋₅ al menos parcialmente fluorado, C₁₋₅-alquilo al menos parcialmente clorado, [(2-Cloro-1,3-tiazol-5-il)-metoxi]-, -(C=O)-H y - (C=O)-C₁₋₅-alquilo, un grupo piridinilo, que es al menos monosustituido por C₁₋₅-alcoxi, un grupo piridiniloxi, que es al menos monosustituido por C₁₋₅-alcoxi, un grupo fenoxi, que es al menos disustituido y un grupo
30 piridiniloxi, que es al menos disustituido,

más preferiblemente W representa un grupo seleccionado del grupo consistente en 5-Dimetilamino-1-naftil, 2-Acetamido-4-metil-5-tiazolil-, Trifluorometil-, Triclorometil-, Isopropil-, Metil-, 2,2,2-Trifluoroethyl-, Etil-, Hexadecil-, 2-Cloroethyl-, n-Propil-, 3-Cloro-Propil-, n-Butil-, Diclorometil-, Clorometil-, Dodecil-, 1-Octil-, 6-(p-toluidino)-2naftil-, 4,5-Dibromo-tiofen-2-il-, cloruro de benzoilo-2-il-, 1-Octadecil-, 4-Bromo-2,5-dicloro-tiofen-3-il-, 2,5-Dicloro-tiofen-3-il-, 5-Cloro-tiofen-2-il-, 1-Decil-, 3,5-Dicloro-4-(2-cloro-4-nitrofenoxo)-fenil-, 2,3-Diclorotiofen-5-il, 3-Bromo-2-cloro-tiofen-5-il-, 3-Bromo-5-cloro-tiofen-2-il-, 2-(Benzoilaminometil)-tiofen-5-il-, 4-(Fenil-sulfonil)-tiofen-2-il-, 2-Fenil-sulfonil-tiofen-5-il-, 2-[1-Metil-5-(trifluorometil)pirazol-3-il]-tiofen-5-il-, 5-Cloro-1,3-dimetilopirazol-4-il-, 3,5-Dimetilisoxazol-4-il-, 4-(2-Cloro-6-nitro-fenoxi)-fenil-, 4-(3-cloro-2-cianofenoxy)-fenil, 2-(2,4-Diclorofenoxy)fenil-, 2,4-Dimetil-1,3-tiazol-5-il-, Metil-metano-sulfonil-, 2,5-Bis-(2,2,2-trifluoroetoxi)-fenil-, 5-(Di-n-propilamino)-1-naftil-, 2,2,5,7,8-Pentametil-croman-6-il-, 5-Cloro-4-nitro-tiofen-2-il-, 2,1,3-Benzotiadiazol-4-il-, 1-Metil-imidazol-4-il-, Benzofurazan-4-il-, 5-(Isoxazol-3-il)-tiofen-2-il-, Vinil-fenil-4-il-, 5-Dicloro-metil-furan-2-il-, 5-Bromo-tiofen-2-il-, 5-(4-Clorobenzoamidometil)-tiofen-2-il-, Dibenzo[b,d]-furan-2-il-, 5-Cloro-3-metilbenzo[b]-tiofen-2-il-, 3-Metoxi-4-(metoxicarbonil)-tiofen-2-il-, 5-[2-(Metiltio)-pirimidin-4-il]-tiofen-2-il-, 4-Cloro-2,1,3-Benzoxadiazol-7-il-, 5-Cloro-2,1,3-Benzoxadiazol-4-il-, 6-Cloro-imidazo(2,1-b)-tiazol-5-il-, 3-Metil-benzo[b]-tieno-2-il-, 4-[(3-Cloro-5-(trifluorometil)-2-piridil-fenil, 4-Metoxi-2,3,6-trimetilbenzoilo, 5-Cloro-1-naftil-, 5-Cloro-2-naftil-, 9,10-Dibromoantracen-2-il-, Isoquinolin-5-il-, 4'-Nitro-bifenil-4-il-, (1,3-Dihidro-1-oxo-2H-isoindol-2-il)-4-fenil-, 5-(2-Metil-1,3-tiazol-4-il)-tiofen-2-il-, 5-(1-Metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-il]-tiofen-2-il-, 5-[5-Trifluorometil]-isoxazol-3-il]-tiofen-2-il-, p-Dodecil-fenil-, 4-[(3-Ciano-4-metoxi-2-piridinilo)oxi]-fenil-, 4-(N-ftalimidinil)-fenil-, 1,2,3,4-Tetrahidro-2-(trifluoroacetil)-isoquinolina-7-il-, 1,2-Dimetilimidazol-4-il-, 2,2,4,6,7-Pentametildihidrobenzofuran-5-il-, 4-Cloro-1-naftil-, 2,5-Dicloro-4-nitro-tiofen-3-il-, 4-(4-Metoxi-fenoxi)-fenil-, [4-(3,5-Diclorofenoxy)fenil]-, [4-(3,4-diclorofenoxy)-fenil-, [4-(3,5)-Bis-

(trifluorometilfenoxi)fenil-, 3-(2-Metoxi-fenoxy)-fenil-, 3-(4-Metoxi-fenil)-fenil-, 3-(4-Cloro-fenil)-fenil-, 3-(3,5-Dicloro-fenil)-fenil-, 3-(3,4-Dicloro-fenil)-fenil-, 3-(4-Fluorofenil)-fenil-, 3-[4-(Trifluorometil)-fenil]-fenil-, 3-[3,5-Bis-(Trifluorometil)-fenil]-fenil-, 4-(2-Metoxi-fenoxy)-fenil-, 4-(2-Metil-fenoxy)-fenil-, 4-(4-Metoxi-fenoxy)-fenil-, 4-(4-Clorofenil)-fenil-, 4-(3,5-Diclorofenil)-fenil-, 4-(3,4-Diclorofenil)-fenil-, 4-(4-Fluorofenil)-fenil-, 4-[4-(Trifluorometil)-fenil]-fenil-, 4-[3,5-Bis-(Trifluorometil)-fenil]-fenil-, Ciclopropil-, 2-(2-Clorofenil)-2-feniletil-, 2-(2-Trifluorometilfenil)-2-feniletil-, 5-[4-Ciano-1-metil-5-(metiltio)-1H-pirazol-3-il-tiofeno-2-il]-, 3-Ciano-2,4-bis-(2,2,2-trifluorotoxi)-fenil-, 4-[(2-Cloro-1,3-tiazol-5-il)-metoxi]-fenil-, 2-(1,3-Dioxo-1,3-dihidro-isoindol-2-il)-etil-, 5-Iodo-1-naftil-, Etil-2,5-dimetil-1-fenilpirrol-4-carboxilato-3-il-, Etil-2-metil-1,5-difenil-1H-pirrol-3-carboxilato-4-il-, Etil-5-(4-clorofenil)-2-metil-3-furoato-4-il, Etil-5-(4-clorofenil)-2-metil-1-fenil-3-carboxilato-4-il-, Etil-2,5-dimetil-3-furoato-4-il-, 3-Cloro-4-(1,3-dioxo-2-Azaspiro[4,4]non-2-il)-fenil-, Coumarin-6-il, 3-(4-Metoxi-fenoxy)-fenil-, [3-3,4-Dicloro-fenoxy)]fenil-, [3-(3,4-Dicloro-fenoxy)-fenil]-3,5-Bis-trifluorometilfenoxfenil-, 2,2-Difenilletil-, 4-Fenil-5-(trifluorometil)-tiofen-3-il-, Metil-4-fenil-5-(trifluorometil)-tiofen-2-carboxilato-3-il-, Metil-1,2,5-trimetilpirrol-3-carboxilato-4-il-, 4-Fluoro-1-naftil-, 5-Fluoro-3-metilbenzo[b]-tiofen-2-il-, Metil-2,5-dimetil-3-furoato-4-il-, Metil-2-furoato-5-il-, Metil-2-metil-3-furoato-5-il-, Metil-1-metil-1H-pirrol-2-carboxilato-5-il-, 2-(5-Cloro-1,2,4-tiadiazol-3-il)-tiofeno-5-il-, 1,3,5-Trimetil-1H-pirazol-4-il-, Pentafluoroetoxitetrafluoroetil-, 5-(5-Isoxacil)-tiofeno-2-il-, 5-(5-Isoxazol-il)-2-furil-, 5-Metil-2,1,3-benzotiadiazol-4-il-, 2,3-Dihidro-1,4-benzodioxine-6-il-, 4-Metil-1-naftil-, 5-Metil-2-(trifluorometil)-3-furil-, 2,3-Dihidrobenzo[b]furan-5-il-, 1-Benzotiofen-3-il-, 4-Metil-3,4-dihidro-2H-1,4-Benzoxazin-7-il-, 5-Metil-1-fenil-1H-pirazol-4-il-, 6-Morfolin-3-piridinil-, 4-(1H-Pirazol-1-il)-fenil-, 6-Fenoxi-3-piridil-, 3,4-Dihidro-2H-1,5-benzodioxepin-7-il-, 5-(1,3-Oxazol-5-il)-2-tienil-, 4-(1,3-Oxazol-5-il)-fenil-, 5-Metil-4-isoxazolil-, 2,1,3-Benzotiadiazol-5-il-, 5-Acetamido-1-naftil-, 3-Metil-8-quinolinil-, 1,3-Benzotiazol-6-il-, 2-Morfolin-3-piridil-, 2,5-Dimetil-3-tienil-, 5-[5-(Clorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]-2-

tienil-, Etil-3-[5-il-2-tienilo]1,2,4-oxadiazol-5-carboxilato-, 3-(5-Metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-fenil-, 4-(Difluorometoxi)-fenil-, 3-(Difluorometoxi)-fenil-, 2,2-Dimetil-6-cromanil-, Etil-3,5-dimetil-1H-pirrol-2-carboxilato-4-il-, Imidazo[1,2-a]piridin-3-il-, 3-(1,3-Oxazol-5-il)-fenil-, Etil-5-[4-il)-fenil]-2-metil-3-furoato, 1-Pirrolidinilfenilsulfonil-, Metil-5-il-4-metil-2-tiofen-carboxilato, Metil-3-il-4-(isopropilsulfonil)-2-tiofeno, 7-Clorocromon-3-il-, 4'-Bromobifenil-4-il-, 4'-Acetilobifenil-4-il-, 4'-Bromo-2'-fluoro-bifenil-4-il-, 1-Metil-5-isatinil-, ácido-2-cloro-3-tiofencarboxilico-5-il-, 2-Metoxi-5-(N-ftalimidinil)-fenil-, 1-Benzotiofen-2-il-, Morfolinfenilsulfonil- y 3-(2-Metil-4-pirimidinil)-fenil-.

6. Compuestos según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, caracterizados porque R¹⁰ representa hidrógeno, un radical alifático C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado, un radical cicloalifático C_{3-C₈} saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente conteniendo al menos un heteroátomo como miembro del anillo; que puede enlazarse vía un grupo alquíleno C_{1-C₆} opcionalmente al menos monosustituido, y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido, o un radical arilo o heteroarilo de 5 o 6 miembros, opcionalmente al menos monosustituido, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclico opcionalmente al menos monosustituido, preferiblemente H, un radical alquilo C₁₋₄ lineal o ramificado, ciclohexilo o un radical fenilo, más preferiblemente H, CH₃, C₂H₅ o fenilo.

7. Compuestos según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, caracterizados porque R¹¹ representa hidrógeno, un radical alifático C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado, un radical cicloalifático C_{3-C₈} saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente contenido al menos un heteroátomo como miembro del anillo, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno C_{1-C₆} opcionalmente al menos monosustituido, y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido, o un radical arilo o heteroarilo de 5 o 6 miembros, opcionalmente al menos monosustituido, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclico opcionalmente al menos monosustituido, preferiblemente H, un radical alquilo C₁₋₄ lineal o ramificado, ciclohexilo o un radical fenilo, más preferiblemente H, CH₃, C₂H₅ o fenilo.
8. Compuestos según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7, caracterizados porque R¹² representa un radical alifático C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado, un radical cicloalifático C_{3-C₈} saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente contenido al menos un heteroátomo como miembro del anillo, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno C_{1-C₆} opcionalmente al menos monosustituido, y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido, o un radical arilo o heteroarilo de 5 o 6 miembros, opcionalmente al menos monosustituido, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclico opcionalmente al menos monosustituido, preferiblemente H, un radical alquilo C₁₋₄ lineal o ramificado, ciclohexilo o un radical fenilo, más preferiblemente H, CH₃, C₂H₅ o fenilo.

9. Compuestos según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, caracterizados porque R¹³ y R¹⁴ son cada uno independientemente seleccionados del grupo consistente en hidrógeno, un radical alifático C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado, un radical cicloalifático C_{3-C₈} saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente conteniendo al menos un heteroátomo como miembro del anillo, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno C_{1-C₆} opcionalmente al menos monosustituido, y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido, o un radical arilo o heteroarilo de 5 o 6 miembros, opcionalmente al menos monosustituido, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclico opcionalmente al menos monosustituido, preferiblemente son cada uno independientemente seleccionados del grupo consistente en H, un radical alquilo C₁₋₄ lineal o ramificado, ciclohexilo y un radical fenilo, más preferiblemente son cada uno independientemente seleccionados del grupo consistente en H, CH₃, C₂H₅ y fenilo.
10. Compuestos según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, caracterizados porque R¹³ y R¹⁴ junto con el átomo puente de nitrógeno forman un anillo heterocíclico de 5 o 6 miembros saturado, insaturado o aromático, que puede ser al menos monosustituido y/o contener al menos un heteroátomo más como miembro del anillo, preferiblemente forman un grupo piperidina o morfolina no sustituido.

11. Compuestos según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10, caracterizados porque R¹⁵ representa hidrógeno, un radical alifático C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado, un radical cicloalifático C_{3-C₈} saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente contenido al menos un heteroátomo como miembro del anillo, o un radical arilo o heteroarilo de 5 o 6 miembros, opcionalmente al menos monosustituido, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclico opcionalmente al menos monosustituido, preferiblemente representa H, un radical alquilo C₁₋₄ lineal o ramificado, ciclohexilo o un radical fenilo, más preferiblemente representa H, CH₃, C₂H₅ o fenilo.

12. Compuestos según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11, caracterizados porque R¹⁶ representa un radical alifático C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado, preferiblemente un radical alquilo C₁₋₃ lineal o ramificado, saturado, no sustituido, más preferiblemente un radical metilo.

13. Compuestos según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 12, caracterizados porque R¹⁷ representa un radical alifático C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado, preferiblemente un radical alquilo C₁₋₃ lineal o ramificado, saturado, no sustituido, más preferiblemente un radical metilo.

14. Compuestos según una o más de las reivindicaciones 1 a 13:

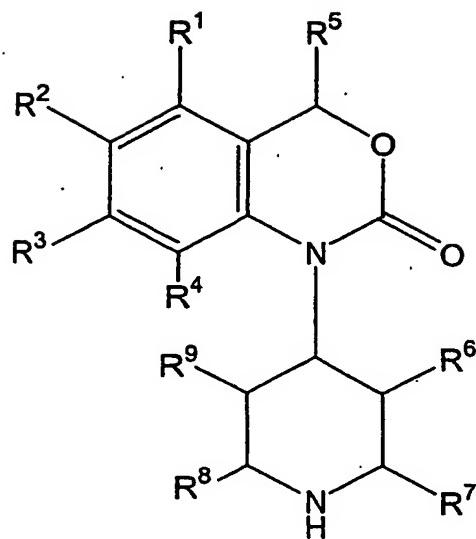
5 1-[1-(5-Cloro-3-metil-benzo[b]tiofenil-2-sulfonil)-piperidin-4-il]-1,4-dihidro-benzo[d][1,3]oxazin-2-ona,

1-[1-(5-Dimetilamino-naftil-1-sulfonil)-piperidin-4-il]-8-metil-1,4-dihidro-benzo[d][1,3]oxazin-2-ona,

10 1-[1-(5-Dimetilamino-naftil-1-sulfonil)-piperidin-4-il]-1,4-dihidro-benzo[d][1,3]oxazin-2-ona,

y sus sales correspondientes, y solvatos correspondientes.

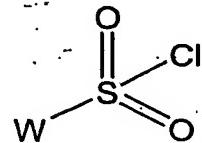
15 15. Proceso para la preparación de compuestos sulfonamídicos derivados de benzoxazinona de fórmula general (I) según una o más de las reivindicaciones 1 a 14, caracterizado porque comprende hacer reaccionar al menos un compuesto piperidínico de fórmula general (II), en el cual R¹ a R⁹ tienen la significación según la reivindicación 1, y/o una sal, preferiblemente un clorhidrato,



(II)

con al menos un compuesto de fórmula general (III),

5



(III)

en la cual W tiene la significación según la reivindicación 1, en un medio de reacción adecuado, opcionalmente en presencia de al menos una base y/o opcionalmente al menos un agente auxiliar.

10

15

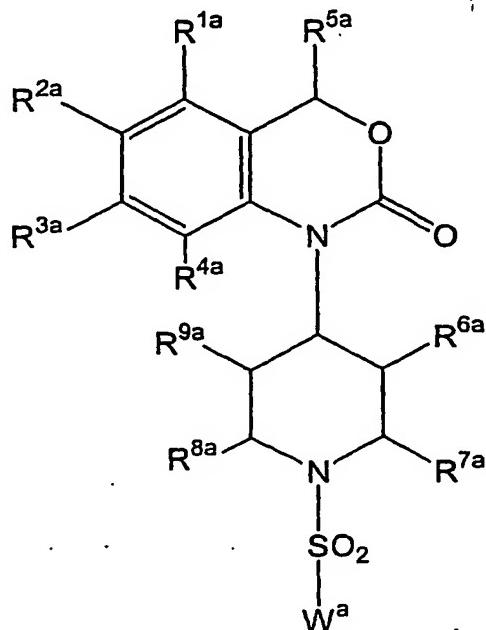
16. Proceso para la preparación de una sal preferiblemente fisiológicamente aceptable de los compuestos sulfonamídicos derivados de benzoxazinona según las reivindicaciones 1-14, caracterizado porque al menos un compuesto de fórmula general (I) con al menos un grupo básico se hace reaccionar con al menos un ácido, preferiblemente ácido

orgánico o mineral, preferiblemente en presencia de un medio de reacción adecuado.

17. Proceso para la preparación de una sal preferiblemente fisiológicamente aceptable de los compuestos sulfonamídicos derivados de benzoxazinona según las reivindicaciones 1-14, caracterizado porque al menos un compuesto de fórmula general (I) con al menos un grupo ácido se hace reaccionar con al menos una base, preferiblemente en presencia de un medio de reacción adecuado.
- 10 18. Medicamento que comprende al menos un compuesto sulfonamídico derivado de benzoxazinona según cualquiera de las reivindicaciones 1-14, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, su racemato o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros en cualquier relación de mezcla, o una de sus sales fisiológicamente aceptables, o un solvato, respectivamente, y opcionalmente uno o más adyuvantes farmacéuticamente aceptables.
- 15 19. Medicamento según la reivindicación 18 para regulación del receptor 5-HT₆, para la mejora de la cognición, para la profilaxis y/o tratamiento de trastornos de la ingestión de alimentos, particularmente para la regulación del apetito, para el mantenimiento, aumento o reducción del peso corporal, para la profilaxis y/o tratamiento de obesidad, bulimia, anorexia, caquexia o diabetes de tipo II (Diabetes mellitus no insulino-dependiente), preferiblemente diabetes de tipo II, que es causada por obesidad, trastornos del sistema nervioso central, trastornos del aparato digestivo, como el síndrome del intestino irritable, ansiedad, pánico, depresión, trastornos cognitivos de la memoria, trastornos de demencia senil, como Morbus Alzheimer, Morbus Parkinson y Morbus Huntington, esquizofrenia, psicosis, hiperkinesia infantil o ADHC (attention deficit, hyperactivity disorders).
- 20
- 25
- 30

20. Uso de al menos un compuesto sulfonamídico derivado de benzoxazinona según cualquiera de las reivindicaciones 1-14, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, 5 preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, su racemato o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros en cualquier relación de mezcla, o una de sus sales fisiológicamente aceptables, o a solvate, para la fabricación de un medicamento para regulación del receptor 5-HT₆, para la mejora de la cognición, para la 10 profilaxis y/o tratamiento de trastornos de la ingestión alimenticia, particularmente para la regulación del apetito, para el mantenimiento, aumento o reducción del peso corporal, para la profilaxis y/o tratamiento de obesidad, bulimia, anorexia, caquexia o diabetes de tipo II (Diabetes mellitus no insulino-dependiente), preferiblemente diabetes de tipo II, 15 que es causada por obesidad, trastornos del sistema nervioso central, trastornos del aparato digestivo, como el síndrome del intestino irritable, ansiedad, pánico, depresión; trastornos cognitivos de la memoria, trastornos de demencia senil; como Morbus Alzheimer, Morbus Parkinson y Morbus Huntington, esquizofrenia, psicosis, hiperkinesia 20 infantil o ADHC (attention deficit, hyperactivity disorders).

21. Uso de al menos un compuesto sulfonamídico derivado de benzoxazinona de fórmula general (Ia),



5

(Ia)

en la cual

10. R^{1a}, R^{2a}, R^{3a}, R^{4a} son cada uno seleccionados independientemente del grupo consistente en hidrógeno, halógeno, un radical alifático, lineal o ramificado, saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, un radical cicloalifático saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente contenido al menos un heteroátomo como miembro del anillo, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno opcionalmente al menos monosustituido, y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido, o un radical arilo o heteroarilo opcionalmente al menos monosustituido, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno opcionalmente al menos monosustituido y/o puede
- 15
- 20

condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos
opcionalmente al menos monosustituido, un grupo nitro, ciano, -OR^{10a}, -
O(C=O)R^{11a}, -(C=O)OR^{11a}, -SR^{12a}, -SOR^{12a}, -SO₂R^{12a}, -NH-SO₂R^{12a}, -
SO₂NH₂ y -NR^{13a}R^{14a},

5

R^{5a} representa hidrógeno, un radical alifático opcionalmente al menos
monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado o un radical
cicloalifático saturado o insaturado, opcionalmente al menos
monosustituido, opcionalmente conteniendo al menos un heteroátomo
como miembro del anillo,

10

R^{6a}, R^{7a}, R^{8a}, R^{9a} son cada uno seleccionados independientemente
del grupo consistente en hidrógeno, un radical alifático opcionalmente al
menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado, un
radical cicloalifático saturado o insaturado, opcionalmente al menos
monosustituido, opcionalmente conteniendo al menos un heteroátomo
como miembro del anillo, un grupo ciano y un -COOR^{15a},

15

W^a representa un radical alifático opcionalmente al menos
monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado, un radical
cicloalifático saturado o insaturado, opcionalmente al menos
monosustituido, opcionalmente conteniendo al menos un heteroátomo
como miembro del anillo, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno
opcionalmente al menos monosustituido, y/o puede condensarse con un
sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos
monosustituido, un radical arilo o heteroarilo opcionalmente al menos
monosustituido, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno o
alquenileno, opcionalmente al menos monosustituido y/o puede
condensarse con un sistema de anillos mono o policíclico opcionalmente
al menos monosustituido, un grupo NR^{16a}R^{17a} o un grupo COR^{18a},

20

25

30

R^{10a} representa hidrógeno, un radical alifático, lineal o ramificado, saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, un radical cicloalifático saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente conteniendo al menos un heteroátomo como miembro del anillo, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno opcionalmente al menos monosustituido, y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido, o un radical arilo o heteroarilo opcionalmente al menos monosustituido, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno opcionalmente al menos monosustituido y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido,

R^{11a} representa hidrógeno, un radical alifático, lineal o ramificado, saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, un radical cicloalifático saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente conteniendo al menos un heteroátomo como miembro del anillo, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno opcionalmente al menos monosustituido, y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido, o un radical arilo o heteroarilo opcionalmente al menos monosustituido, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno opcionalmente al menos monosustituido y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido,

R^{12a} representa un radical alifático, lineal o ramificado, saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, un radical cicloalifático saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente conteniendo al menos un heteroátomo como miembro del anillo, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno opcionalmente al menos monosustituido, y/o puede condensarse con un

sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido, o un radical arilo o heteroarilo opcionalmente al menos monosustituido, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno opcionalmente al menos monosustituido y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido,

5

R^{13a} y R^{14a} son cada uno seleccionados independientemente del grupo consistente en hidrógeno, un radical alifático, lineal o ramificado, saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, un radical cicloalifático saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente contenido al menos un heteroátomo como miembro del anillo, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno opcionalmente al menos monosustituido, y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido, o un radical arilo o heteroarilo opcionalmente al menos monosustituido, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno opcionalmente al menos monosustituido y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido,

10

15

20

25

30

o bien R^{13a} y R^{14a} junto con el átomo puente de nitrógeno forman un anillo heterocíclico saturado, insaturado o aromático, opcionalmente al menos monosustituido, que puede contener al menos un heteroátomo adicional como miembro del anillo,

R^{15a} representa hidrógeno, un radical alifático, lineal o ramificado, saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, un radical cicloalifático saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente contenido al menos un heteroátomo como miembro del anillo, o un radical arilo o heteroarilo opcionalmente al menos monosustituido, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno

opcionalmente al menos monosustituido, y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido,

5 R^{16a} representa un radical alifático opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado,

10 R^{17a} representa un radical alifático opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado, y

15 R^{18a} representa un radical arilo opcionalmente al menos monosustituido,

20 opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, su racemato o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, en cualquier relación de mezcla, o una de sus sales fisiológicamente aceptables, o un solvato, respectivamente,

25 para la fabricación de un medicamento para regulación del receptor 5-HT₆.

22. Uso según la reivindicación 21, caracterizado porque que R^{1a}, R^{2a}, R^{3a}, R^{4a} son cada uno independientemente seleccionados del grupo consistente en H, F, Cl, Br, un radical alifático C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado, un radical cicloalifático C_{3-C₈} saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente conteniendo al menos un heteroátomo como miembro del anillo, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno C_{1-C₆} opcionalmente al menos monosustituido, y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido, un radical arilo o heteroarilo de 5 o 6 miembros opcionalmente al menos monosustituido, que puede

- enlazarse vía un grupo alquíleno C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclico opcionalmente al menos monosustituido, un grupo nitro, ciano, -OR^{10a}, -OC(=O)R^{11a}, -SR^{12a}, -SOR^{12a}, -SO₂R^{12a}, -NH-SO₂R^{12a}, -SO₂NH₂ y -NR^{13a}R^{14a}, preferiblemente seleccionados del grupo consistente en H, F, Cl, Br, un radical alifático-C₁₋₃ opcionalmente al menos monosustituido, ramificado o lineal, saturado, un radical cicloalifático C₅ o C₆ saturado, opcionalmente al menos monosustituido; opcionalmente conteniendo al menos un heteroátomo como miembro del anillo, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno C₁ o C₂ opcionalmente al menos monosustituido, un grupo nitro, ciano, -OR^{10a}, -OC(=O)R^{11a}, -SR^{12a} y -NR^{13a}R^{14a}, más preferiblemente seleccionados del grupo consistente en H, F, Cl, CH₃, CH₂CH₃, CF₃, CF₂CF₃, ciclopentilo, ciclohexilo, nitro, ciano y -OR^{10a}.
- 15 23. Uso según las reivindicaciones 21 o 22, caracterizado porque R⁵ representa hidrógeno, un radical alifático C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado, un radical cicloalifático C₃-C₈ saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente conteniendo al menos un heteroátomo como miembro del anillo; preferiblemente representa H o un radical alquilo C₁₋₃ ramificado o lineal, más preferiblemente representa H, CH₃ o CH₂CH₃.
- 20 24. Uso según cualquiera de las reivindicaciones 21 a 23, caracterizados porque R^{6a}, R^{7a}, R^{8a}, R^{9a} son cada uno independientemente seleccionados del grupo consistente en hidrógeno, un radical alifático C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado, un radical cicloalifático C₃-C₈ saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente conteniendo al menos un heteroátomo como miembro del anillo, un grupo ciano y un grupo COOR^{15a}, preferiblemente seleccionados del grupo consistente en

H, un radical alquilo C₁₋₃ ramificado o lineal, un grupo ciano y un grupo COOR^{15a}, más preferiblemente del grupo consistente en H, CH₃, CH₂CH₃ y un grupo ciano.

- 5 25. Uso según cualquiera de las reivindicaciones 21 a 24, caracterizado porque W^a representa un radical alifático C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado, un radical cicloalifático C_{3-C₈} saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente conteniendo al menos un heteroátomo como miembro del anillo, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno C_{1-C₆} opcionalmente al menos monosustituido, y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido, un radical arilo o heteroarilo de 5 o 6 miembros opcionalmente al menos monosustituido, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclico opcionalmente al menos monosustituido; un grupo NR^{16a}R^{17a} o un grupo COR^{18a},
- 10 preferiblemente se selecciona del grupo consistente en 1-Naftil-, 5-Dimetilamino-1-naftil, 2-Naftil-, 2-Acetamido-4-metil-5-tiazolil-, 2-Tienil-, 8-Quinolinil-, Fenil-, Pentafluorofenil-, 2,4,5-Tricloro-fenil-, 2,5-Dicloro-fenil-, 2-Nitrofenil-, 2,4-Dinitro-fenil-, 3,5-Dicloro-2-hidroxi-fenil-, 2,4,6-Trisisopropil-fenil-, 2-Mesitil-, 3-Nitro-fenil-, 4-Bromo-fenil-, 4-Fluoro-fenil-, 4-Clorofenil-, 4-Cloro-3-nitro-fenil-, 4-Iodo-fenil-, N-Acetilsulfanilil-, 4-Nitro-fenil-, 4-Metoxi-fenil-, Ácido benzoico-4-il-, 4-tert-Butil-fenil-, p-Tolil-, Trifluorometil-, Triclorometil-, Isopropil-, Metil-, Bencil-, trans-estiril-, 2,2,2-Trifluoroethyl-, Etil-, Hexadecil-, 2-Cloroethyl-, n-Propil-, 3-Cloro-propil-, n-Butil-, Metil-benzoato-2-il-, 2-Nitro-4-(trifluorometil)-fenil-, Pentametil-fenil-, 2,3,5,6-Tetrametil-fenil-, 3-(Trifluorometil)-fenil-, 3,5-Bis-(Trifluorometil)-fenil-, Diclorometil-, Clorometil-, Dodecil-, 1-Octil-, 2,3,4-Tricloro-fenil-, 2,5-Dimetoxi-fenil-, o-Tolil-, p-xilil-2-il-
- 15
- 20
- 25
- 30

, Ácido benzoico-3-il-, 4-Cloro-3-(trifluorometil)-fenil-, ácido 4-cloro-5-nitro-benzoico-3-il-, 6-(p-toluidin)-2-naftil-, 4-Metoxi-2,3,6-trimetilfenil-, 3,4-Diclorofenil-, 4,5-Dibromo-tiofen-2-il-, 3-Cloro-4-fluoro-fenil-, 4-Etil-fenil-, 4-n-Propil-fenil-, 4-(1,1-Dimetilopropil)-fenil-, 4-Isopropil-fenil-, 4-Bromo-2,5-difluoro-fenil-, 2-Fluoro-fenil-, 3-Fluoro-fenil-, 4-(Trifluorometoxi)-fenil-, 4-(Trifluorometil)-fenil-, 2,4-Difluoro-fenil-, 2,4-Dicloro-5-metil-fenil-, 4-Cloro-2,5-dimetil-fenil-, 5-Dietilamino-2-naftil-, Cloruro de benzoil-3-il-, 2-Cloro-fenil-, 1-Octadecil-, 4-Bromo-2,5-dicloro-tiofen-3-il-, 2,5-Dicloro-tiofen-3-il-, 5-Cloro-tiofen-2-il-, 2-Metil-5-nitro-fenil-, 2-(Trifluorometil)-fenil-, 3-Cloro-fenil-, 3,5-Dicloro-fenil-, 1-Decil-, 3-Metil-fenil-, 2-Cloro-6-metil-, 5-Bromo-2-metoxi-fenil-, 3,4-Dimetoxi-fenil-, 2-3-Dicloro-fenil-, 2-Bromo-fenil-, 3,5-Dicloro-4-(2-cloro-4-nitrofenoxi)-fenil-, 2,3-Dicloro-tiofen-5-il-, 3-Bromo-2-cloro-tiofen-5-il-, 3-Bromo-5-cloro-tiofen-2-il-, 2-(Benzolioáminometil)-tiofen-5-il-, 4-(Fenilsulfonil)-tiofen-2-il-, 2-Fenilsulfoniltiofen-5-il-, 3-Cloro-2-metil-fenil-, 2-[1-Metil-5-(trifluorometilo)pirazol-3-il]-tiofen-5-il-, 5-Pirid-2-il-tiofen-2-il-, 2-Cloro-5-(trifluorometil)-fenil-, 2,6-Dicloro-fenil-, 3-Bromo-fenil-, 2-(Trifluorometoxi)-fenil-, 4-Ciano-fenil-, 2-Ciano-fenil-, 4-n-Butoxi-fenil-, 4-Aacetamido-3-cloro-fenil-, 2,5-Dibromo-3,6-difluoro-fenil-, 5-Cloro-1,3-dimetilopirazol-4-il-, 3,5-Dimetilisoxazol-4-il-, 2-(2,4-Diclorofenoxi)-fenil-, 4-(2-Cloro-6-nitrofenoxi)-fenil-, 4-(3-Cloro-2-ciano-fenoxi)-fenil-, 2,4-Dicloro-fenil-, 2,4-Dimetil-1,3-tiazol-5-il-, Metil-metano-sulfonil-, 2,5-Bis-(2,2,2-Trifluoroetoxi)-fenil-, 2-Cloro-4-(trifluorometil)-fenil-, 2-Cloro-4-fluoro-fenil-, 5-Fluoro-2-metil-fenil-, 5-Cloro-2-metoxi-fenil-, 2,4,6-Tricloro-fenil-, ácido-2-hidroxi-benzoico-5-il-, 5-(Di-n-propilamino)-1-naftil-, 6-Metoxi-m-tolil-, 2,5-Difluoro-fenil-, 2,4-Dimetoxi-fenil-, 2,5-Dibromo-fenil-, 3,4-Dibromo-fenil-, 2,2,5,7,8-Pentametilcroman-6-il-, ácido-2-metoxi-benzoico-5-il-, 5-Cloro-4-nitro-tiofen-2-il-, 2,1,3-Benzotiadiazol-4-il-, 1-Metil-imidazol-4-il-, Benzofurazan-4-il-, 2-(Metoxicarbonil)-tiofen-3-il-, 5-(Isoxazol-3-il)-

5 tiofen-2-il-, 2,4,5-Trifluoro-fenil-, Bifenil-4-il-, Vinil-fenil-4-il-, 2-Nitro-bencil-, 5-Dicloro-metil-furan-2-il-, 5-Bromo-tiofen-2-il-, 5-(4-Chlorobenzoamidometil)-tiofen-2-il-, 2,6-Difluoro-fenil-, 2,5-Dimetoxi-4-nitro-fenil-, Dibenzo[b,d]-furan-2-il-, 2,3,4-Trifluoro-fenil-, 3-Nitro-p-tolil-, 4-Metoxi-2-nitro-fenil-, 3,4-Difluoro-fenil-, 4-(Bromoethyl)-fenil-, 3,5-Dicloro-4-hidroxi-fenil-, 4-n-Amilofenil-, 5-Chloro-3-metilbenzo[b]-tiofen-2-il-, 3-Metoxi-4-(metoxicarbonil)-tiofen-2-il-, 4-n-Butil-fenil-, 2-Chloro-4-ciano-fenil-, 5-[2-(Metiltio)-pirimidin-4-il]-tiofen-2-il-, 3,5-Dinitro-4-metoxi-fenil-, 4-Bromo-2-(trifluorometoxi)-fenil-, 4-Chloro-2,1,3-Benzoxadiazol-7-il-, 2-(1-Naftil)-etyl-, 3-Ciano-fenil-, 5-Chloro-2,1,3-Benzoxadiazol-4-il-, 3-Chloro-4-metil-fenil-, 4-Bromo-2-etyl-fenil-, 2,4-Dicloro-6-metil-fenil-, 6-Chloro-imidazo(2,1-b)-tiazol-5-il-, 3-Metil-benzo[b]-tiofeno-2-il-, 4-Metil-sulfonil-fenil-, 2-Metil-sulfonil-fenil-, 4-Bromo-2-metil-fenil-, 2,6-Dicloro-4-(trifluorometil)-fenil-, 4-[3-Chloro-5-(trifluorometil)-2-piridinilo]oxi]-fenil-, 5-Chloro-nafta-1-il-, 5-Chloro-2-naftil-, 9,10-Dibromoantracen-2-il-, Isoquinolin-5-il-, 4-Metoxi-2,3,6-trimetil-fenil-, 4'-Nitro-bifénil-4-il-, [(4-Fenoxi)-fénil-, (1,3-Dihidro-1-oxo-2H-isoindol-2-il)-4-fenil-, 4-Acetyl-fenil-, 5-(2-Metil-1,3-tiazol-4-il)-tiofen-2-il-, 5-(1-Metil-3-(trifluorometilo)pirazol-5-il]-tiofen-2-il-, 5-[5-Trifluorometil)-isoxazol-3-il]-tiofen-2-il-, 2-Iodo-fenil-, p-Dodecilfenil-, 4-[(3-Ciano-4-metoxi-2-piridinilo)oxi]-fenil-, 4-(N-ftalimidinil)-fenil-, 1,2,3,4-Tetrahidro-2-(trifluoroacetil)-isoquinolin-7-il-, 4-Bromo-2-fluoro-fenil-, 2-Fluoro-5-(trifluorometil)-fenil-, 4-Fluoro-2-(trifluorometil)-fenil-, 4-Fluoro-3-(trifluorometil)-fenil-, 2,4,6-Trifluoro-fenil-, 3-(Trifluorometoxi)-fenil-, 1,2-Dimetilimidazol-4-il-, Etil-4-Carboxilato-3-il-, 2,2,4,6,7-Pentametildihidrobenzofuran-5-il-, 3-Bromo-2-cloropiridin-5-il-, 3-Metoxi-fenil-, 2-Metoxi-4-metil-fenil-, ácido 2-Chloro-4-fluoro benzoico-5-il-, 4-Chloro-1-naftil-, 2,5-Dicloro-4-nitro-tiofen-3-il-, 4-(4-Metoxi-fenoxi)-fenil-, 4-(4-Chloro-fenoxi)-fenil-, 4-(3,5-Dicloro-fenoxi)-fenil-, 4-(3,4-Dicloro-fenoxi)-fenil-, 4-(4-Fluoro-fenoxi)-fenil-

, 4-(4-Metil-fenoxy)-fenil-, 4-[4-(Trifluorometil)-fenoxy-fenil-, 4-[3,5-Bis-(trifluorometil)-fenoxy]-fenil-, 3-(2-Metoxi-fenoxy)-fenil-, [3-(2-Chloro-fenoxy)-fenil-, 3-(2-Metil-fenoxy)-fenil-, 4-[2-(Trifluorometil)-fenoxy]-fenil-, 3-Fenil-fenil-, 3-(4-Metoxi-fenil)-fenil-, 3-(4-Chloro-fenil)-fenil-, 3-(3,5-Dicloro-fenil)-fenil-, 3-(3,4-Dicloro-fenil)-fenil-, 3-(4-Fluorofenil)-fenil-, 3-(4-Metilfenil)-fenil-, 3-[4-(Trifluorometil)-fenil]-fenil-, 3-[3,5-Bis-(trifluorometil)-fenoxy]-fenil-, 4-(4-Piridiloxi)-fenil-, 4-(2-Metoxi-fenoxy)-fenil-, 4-(2-Chloro-fenoxy)-fenil-, 4-(2-Metil-fenoxy)-fenil-, 4-(4-Metoxi-fenoxy)-fenil-, 4-(4-Chlorofenil)-fenil-, 4-(3,5-Diclorofenil)-fenil-, 4-(3,4-Diclorofenil)-fenil-, 4-(4-Fluorofenil)-fenil-, 4-(4-Metilfenil)-fenil-, 4-[4-(Trifluorometil)-fenoxy]-fenil-, 4-[3,5-Bis-(Trifluorometil)-fenoxy]-fenil-, [3-(Trifluorometil)-fenoxy]-metil-, (4-Chlorofenil)-metil-, (3,5-Diclorofenil)-metil-, (3,5-Diclorofenil)-metil-, (4-Fluorofenil)-metil-, 4-Metilfenilometil-, [4-(Trifluorometil)-fenoxy]-metil-, Ciclopropil-, 2-(2-Chlorofenil)-2-feniletil-, 2-(2-Trifluorometilfenil)-2-feniletil-, 5-[4-Ciano-1-metil-5-(metiltio)-1H-pirazol-3-il-tiofen-2-il]-, 3-Ciano-2,4-bis-(2,2,2-Trifluorotoxi)-fenil-, 4-[(2-Chloro-1,3-Tiazol-5-il)-metoxi]-fenil-, 3-Nitro-fenilmetil-, 4-Formilfenil-, 2-(1,3-Dioxo-1,3-dihidro-isoindol-2-il)-etil-, [3,5-Bis-(Trifluorometil)-fenoxy]-metil-, (4-(2-Piridiloxi)-fenil)-, (4-(3-Piridiloxi)-fenil)-, 5-Iodo-1-naftil-, Etil-2,5-dimetil-1-fenilopirrol-4-carboxilato-3-il-, Etil-2-metil-1,5-difenil-1H-pirrol-3-carboxilato-4-il-, Etil-5-(4-chlorofenil)-2-metil-3-furoato-4-il, Etil-5-(4-chlorofenil)-2-metil-1-fenil-3-carboxilato-4-il-, Etil-2,5-dimetil-3-furoato-4-il-, 3-Chloro-4-(1,3-dioxo-2-azaspiro[4,4]non-2-il)-fenil-, 5-Bromo-2,4-difluoro-fenil-, 5-Chloro-2,4-difluorofenil-, Coumarin-6-il, 2-Metoxi-fenil-, (3-Fenoxy)-fenil-, 3-(4-Metoxi-fenoxy)-fenil-, 3-(4-Chlorofenoxy)-fenil-, 3-(3,5-Diclorofenoxy)-fenil-, 3-(3,4-Diclorofenoxy)-fenil-, 3-(4-Fluorofenoxy)-fenil-, 3-(4-Metilfenoxy)-fenil-, 3-[4-(Trifluorometil)-fenoxy]-fenil-, 3-[3,5-(Trifluorometil)-fenoxy]-fenil-, 3-[2-(Trifluorometil)-fenoxy]-fenil-, 2,2-Difeniletil-, 4-Fenil-5-(trifluorometil)-tiofen-3-il-, Metil-4-fenil-5-(Trifluorometil)-tiofen-2-

carboxilato-3-il-, Metil-1,2,5-trimetilpirrol-3-carboxilato-4-il-, 4-Fluoro-1-naftil-, 3,5-Difluorofenil-, 3-Fluoro-4-metoxi-fenil-, 4-Cloro-2,5-difluorofenil-, 2-Cloro-4,5-difluoro-fenil-, 5-Fluoro-3-metilbenzo[b]-tiofeno-2-il-, Metil-3-fenilopropionato-4-il, Ácido dihidrocinámico-4-il-, Metil-2,5-dimetil-3-furoato-4-il-, Metil-2-furoato-5-il-, Metil-2-metil-3-furoato-5-il-, Metil-1-metil-1H-pirrol-2-carboxilato-5-il-, 2-(5-Cloro-1,2,4-tiadiazol-3-il)-tiofen-5-il-, 1,3,5-Trimetil-1H-pirazol-4-il-, 3-Cloro-5-fluoro-2-Metilfenil-, Pentafluoroetoxitetrafluoroetyl-, 5-(5-Isoxacil)-tiofen-2-il-, 5-(5-Isoxazol-il)-2-furil-, 5-Metil-2,1,3-benzotiadiazol-4-il-, Bifenil-2-il-, 2,3-Dihidro-1,4-benzodioxine-6-il-, 4-Metil-1-Naftil-, 5-Metil-2-(trifluorometil)-3-furil-, 2,3-Dihidrobenzo[b]furan-5-il-, 1-Benzotiofen-3-il-, 4-Metil-3,4-dihidro-2H-1,4-Benzoxazin-7-il-, 5-Metil-1-fenil-1H-pirazol-4-il-, 6-Morfolin-3-piridinil-, 4-(1H-Pirazol-1-il)-fenil-, 6-Fenoxi-3-piridil-, 3,4-Dihidro-2H-1,5-benzodioxepina-7-il-, 5-(1,3-Oxazol-5-il)-2-tienil-, 4-(1,3-Oxazol-5-il)-fenil-, 5-Metil-4-isoxazolil-, 2,1,3-Benzotiadiazol-5-il-, 3-Tienil-, 2-metil-bencil-, 3-Cloro-bencil-, 5-Acetamido-1-naftil-, 3-Metil-8-quinolinil-, 4-Cloro-2-nitrofenil-, 6-Quinolinil-, 1,3-Benzotiazol-6-il-, 2-Morfolin-3-piridil-, 2,5-Dimetil-3-tienil-, 5-[5-(Clorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]-2-tienil-, Etil-3-[5-il-2-tienilo]1,2,4-oxadiazol-5-carboxilato-, 3-(5-Metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-fenil-, 4-Isopropoxifenil-, 2,4-Dibromofenil-, 3-Ciano-4-fluorofenil-, 2,5-Bis-(trifluorometil)-fenil-, 2-Bromo-4-fluorofenil-, 4-Bromo-3-fluorofenil-, 4-(Difluorometoxi)-fenil-, 3-(Difluorometoxi)-fenil-, 5-Cloro-2-fluoro-fenil-, 3-Cloro-2-fluorofenil-, 2-Fluoro-4-metilfenil-, 4 Nitro-3-(trifluorometil)-fenil-, 3-Fluoro-4-metilfenil-, 4-Fluoro-2-metilfenil-, 4-Bromo-3-(trifluorometil)-fenil-, 4-Bromo-2-(trifluorometil)-fenil-, 3-Bromo-5-(trifluorometil)-fenil-, 2-Bromo-4-(trifluorometil)-fenil-, 2-Bromo-5-(trifluorometil)-fenil-, 2,4-Dicloro-5-fluorofenil-, 4,5-Dicloro-2-fluorofenil-, 3,4,5-Trifluorofenil-, 4-Cloro-2-fluorofenil-, 2-Bromo-4,6-Difluorofenil-, 2-Etilfenil-, 4-Bromo-2-clorofenil-, 4-Bromo-2,6-diclorofenil-, 2-Bromo-4,6-

- dicloro-fenil-, 4-Bromo-2,6-dimetilfenil-, 3,5-Dimetilfenil-, 4-Bromo-
3-Metilfenil-, 2-Metoxi-4-nitrofenil-, 2,2-Dimetil-6-cromanil-, Etil-
3,5-dimetil-1H-pirrol-2-carboxilato-4-il-, Imidazo[1,2-a]piridin-3-il-,
3-(1,3-Oxazol-5-il)-fenil-, Etil-5-[4-il]-fenil]-2-metil-3-furoato, Metil-
5
3-(il)-4-metoxibenzoato, 1-Pirrolidinilfenilsulfonil-, Metil-5-il-4-metil-
2-tiofen-carboxilato, Metil-3-il-4-(isopropilsulfonil)-2-tiofeno, 2-
Piridil-, 3-Fluoro-4-nitrofenil-, 7-Clorocroman-3-il-, 4'-Bromobifenil-
4-il-, 4'-Acetilobifenil-4-il-, 4'-Bromo-2'-fluoro-bifenil-4-il-, 2-Cloro-
4-(3-propil-ureido)-fenil-, 3-(Bromoacetil)-fenil-, 2-Bromo-3-
10
(trifluorometil)-fenil-, 1-Metil-5-isatinil-, ácido 4-Isopropil-benzoico-
3-il-, ácido 2-Cloro-3-tiofencarboxilico-5-il-, 3-Piridil-,
ciclohexilometil-, 2-Metoxi-5-(N-ftalimidinil)-fenil-, 1-Benzotiofen-2-
il-, Morfolinfenilsulfonil-, 3-(2-Metil-4-pirimidinil)-fenil-, y 2-Ciano-5-
metilfenil-,
15
26. Uso según cualquiera de las reivindicaciones 21 a 25, caracterizado
porque R^{10a} representa hidrógeno, un radical alifático C₁₋₆ opcionalmente
al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado, un
radical cicloalifático C_{3-C₈} saturado o insaturado, opcionalmente al
menos monosustituido, opcionalmente contenido al menos un
20
heteroátomo como miembro del anillo, que puede enlazarse vía un
grupo alquíleno C_{1-C₆} opcionalmente al menos monosustituido, y/o
puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos
opcionalmente al menos monosustituido, o un radical arilo o heteroarilo
de 5 o 6 miembros, opcionalmente al menos monosustituido, que puede
enlazarse vía un grupo alquíleno C₁₋₆ opcionalmente al menos
25
monosustituido y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono
o policíclico opcionalmente al menos monosustituido, preferiblemente H,
un radical alquilo C₁₋₄ lineal o ramificado, ciclohexilo o un radical fenilo,
más preferiblemente H, CH₃, C₂H₅ o fenilo.
30

27. Uso según cualquiera de las reivindicaciones 21 a 26, caracterizado porque R^{11a} representa hidrógeno, un radical alifático C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado, un radical cicloalifático C_{3-C₈} saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente contenido al menos un heteroátomo como miembro del anillo, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno C_{1-C₆} opcionalmente al menos monosustituido, y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido, o un radical arilo o heteroarilo de 5 o 6 miembros, opcionalmente al menos monosustituido, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclico opcionalmente al menos monosustituido, preferiblemente H, un radical alquilo C₁₋₄ lineal o ramificado, ciclohexilo o un radical fenilo, más preferiblemente H, CH₃, C₂H₅ o fenilo.
28. Uso según cualquiera de las reivindicaciones 21 a 27, caracterizado porque R^{12a} representa un radical alifático C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado, un radical cicloalifático C_{3-C₈} saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente contenido al menos un heteroátomo como miembro del anillo, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno C_{1-C₆} opcionalmente al menos monosustituido, y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido, o un radical arilo o heteroarilo de 5 o 6 miembros, opcionalmente al menos monosustituido, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclico opcionalmente al menos monosustituido, preferiblemente H, un radical alquilo C₁₋₄ lineal o ramificado, ciclohexilo o un radical fenilo, más preferiblemente H, CH₃, C₂H₅ o fenilo.

29. Uso según cualquiera de las reivindicaciones 21 a 28, caracterizado porque R^{13a} y R^{14a} son cada uno independientemente seleccionados del grupo consistente en hidrógeno, un radical alifático C_{1-6} opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado, un radical cicloalifático C_3-C_8 saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente conteniendo al menos un heteroátomo como miembro del anillo, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno C_1-C_6 opcionalmente al menos monosustituido, y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido, o un radical arilo o heteroarilo de 5 o 6 miembros, opcionalmente al menos monosustituido, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno C_{1-6} opcionalmente al menos monosustituido y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclico opcionalmente al menos monosustituido, preferiblemente son cada uno independientemente seleccionados del grupo consistente en H, un radical alquilo C_{1-4} lineal o ramificado, ciclohexilo y un radical fenilo, más preferiblemente son cada uno independientemente seleccionados del grupo consistente en H, CH_3 , C_2H_5 y fenilo.
30. Uso según cualquiera de las reivindicaciones 21 a 28, caracterizado porque R^{13a} y R^{14a} junto con el átomo puente de nitrógeno forman un anillo heterocíclico de 5 o 6 miembros saturado, insaturado o aromático, que puede ser al menos monosustituido y/o contener al menos un heteroátomo más como miembro del anillo, preferiblemente forman un grupo piperidina o morfolina no sustituido.

- 5 31. Uso según cualquiera de las reivindicaciones 21 a 30, caracterizado porque R^{15a} representa hidrógeno, un radical alifático C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado, un radical cicloalifático C_{3-C₈} saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente conteniendo al menos un heteroátomo como miembro del anillo, o un radicalo arilo o heteroarilo, opcionalmente al menos monosustituido, que puede enlazarse vía un grupo alquíleno C_{1-C₆} opcionalmente al menos monosustituido, y/o puede condensarse con un sistema de anillos mono o policíclicos opcionalmente al menos monosustituido, preferiblemente representa H, un radical alquilo C₁₋₄ lineal o ramificado, ciclohexilo o un radical fenilo, más preferiblemente representa H, CH₃, C₂H₅ o fenilo.
- 10 32. Uso según cualquiera de las reivindicaciones 21 a 31, caracterizado porque R^{16a} representa un radical alifático C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado, preferiblemente un radical alquilo C₁₋₃ no sustituido, lineal o ramificado, saturado, más preferiblemente un radical metilo.
- 15 33. Uso según cualquiera de las reivindicaciones 21 a 32, caracterizado porque R^{17a} representa un radical alifático C₁₋₆ opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, lineal o ramificado, preferiblemente un radical alquilo C₁₋₃ no sustituido, lineal o ramificado, saturado, más preferiblemente un radical metilo.
- 20 34. Uso según cualquiera de las reivindicaciones 21 a 33, caracterizado porque uno o más compuestos sulfonamídicos derivados de benzoxazinona de fórmula general (Ia) se seleccionan del grupo consistente en:
- 25
- 30

- 1-[1-(Naftil-1-sulfonil)-piperidin-4-il]-1,4-dihidro-
benzo[d][1,3]oxazin-2-ona,
- 5 1-(1-Fenilsulfonilpiperidin-4-il]-1,4-dihidro-benzo[d][1,3]-oxazin-2-
ona,
- 10 1-[1-(5-Cloro-3-metil-benzo[b]tiofenil-2-sulfonil)-piperidin-4-il]-1,4-
dihidro-benzo[d][1,3]oxazin-2-ona,
- 15 8-Metil-1-[1-naftil-1-sulfonil)-piperidin-4-il]-1,4-dihidro-
benzo[d][1,3]oxazin-2-ona,
- 20 1-[1-(Quinolin-8-sulfonil)-piperidin-4-il]-1,4-dihidro-
benzo[d][1,3]oxazin-2-ona,
- 25 8-Metil-1-[1-(Quinolin-8-sulfonil)-piperidin-4-il]-1,4-dihidro-
benzo[d][1,3]oxazin-2-ona,
- 30 1-[1-(5-Dimetilamino-naftil-1-sulfonil)-piperidin-4-il]-8-metil-1,4-
dihidrobenzo[d][1,3]oxazin-2-ona,
- 1-[1-(5-Dimetilamino-naftil-1-sulfonil)-piperidin-4-il]-1,4-dihidro-
benzo[d][1,3]oxazin-2-ona,
- 1-[1-(2,3-Dicloro-fenilsulfonil)-piperidin-4-il]-1,4-dihidro-
benzo[d][1,3]oxazin-2-ona,
- 1-[1-(2,3-Dicloro-fenilsulfonil)-piperidin-4-il]-8-metil-1,4-dihidro-
benzo[d][1,3]oxazin-2-ona, y
30 sus sales correspondientes, o sus solvatos correspondientes.

35. Uso de al menos un compuesto sulfonamídico derivado de benzoxazinona de fórmula general (Ia) según cualquiera de las reivindicaciones 21-34, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, su racemato o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros en cualquier relación de mezcla, o una de sus sales fisiológicamente aceptables, o un solvato correspondiente, para la fabricación de un medicamento para la profilaxis y/o tratamiento de trastornos alimentarios.

10

36. Uso según la reivindicación 35 para la regulación del apetito.

37. Uso según la reivindicación 35 para la reducción, aumento o mantenimiento del peso corporal.

15

38. Uso según la reivindicación 35 para la profilaxis y/o tratamiento de obesidad.

20

39. Uso según la reivindicación 35 para la profilaxis y/o tratamiento de bulimia.

40. Uso según la reivindicación 35 para la profilaxis y/o tratamiento de anorexia.

25

41. Uso según la reivindicación 35 para la profilaxis y/o tratamiento de caquexia.

42. Uso según la reivindicación 35 para la profilaxis y/o tratamiento de diabetes de tipo II.

30

43. Uso de al menos un compuesto sulfonamídico derivado de benzoxazinona de fórmula general (Ia) según cualquiera de las reivindicaciones 21-34, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, su racemato o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros en cualquier relación de mezcla, o una de sus sales fisiológicamente aceptables, o un solvato correspondiente, para la fabricación de un medicamento para la profilaxis y/o tratamiento de ansiedad.
44. Uso de al menos un compuesto sulfonamídico derivado de benzoxazinona de fórmula general (Ia) según cualquiera de las reivindicaciones 21-34, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, su racemato o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros en cualquier relación de mezcla, o una de sus sales fisiológicamente aceptables, o un solvato correspondiente, para la fabricación de un medicamento para la profilaxis y/o tratamiento del pánico.
45. Uso de al menos un compuesto sulfonamídico derivado de benzoxazinona de fórmula general (Ia) según cualquiera de las reivindicaciones 21-34, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, su racemato o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros en cualquier relación de mezcla, o una de sus sales fisiológicamente aceptables, o un solvato correspondiente, para la fabricación de un medicamento para la profilaxis y/o tratamiento de la depresión.

46. Uso de al menos un compuesto sulfonamídico derivado de benzoxazinona de fórmula general (Ia) según cualquiera de las reivindicaciones 21-34, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, su racemato o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros en cualquier relación de mezcla, o una de sus sales fisiológicamente aceptables, o un solvato correspondiente, para la fabricación de un medicamento para la profilaxis y/o tratamiento de trastornos cognitivos, preferiblemente trastornos de la memoria.
- 5
- 10
47. Uso de al menos un compuesto sulfonamídico derivado de benzoxazinona de fórmula general (Ia) según cualquiera de las reivindicaciones 21-34, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, su racemato o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros en cualquier relación de mezcla, o una de sus sales fisiológicamente aceptables, o un solvato correspondiente, para la fabricación de un medicamento para la profilaxis y/o tratamiento de procesos de demencia senil, preferiblemente seleccionados del grupo 15 consistente en Morbus Alzheimer, Morbus Parkinson, Morbus Huntington.
- 20
- 25
- 30
48. Uso de al menos un compuesto sulfonamídico derivado de benzoxazinona de fórmula general (Ia) según cualquiera de las reivindicaciones 21-34, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, su racemato o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros en cualquier relación de mezcla, o una de sus sales fisiológicamente aceptables, o un solvato correspondiente, para la fabricación de un medicamento para la profilaxis y/o tratamiento de psicosis.

49. Uso de al menos un compuesto sulfonamídico derivado de benzoxazinona de fórmula general (Ia) según cualquiera de las reivindicaciones 21-34, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, su racemato o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros en cualquier relación de mezcla, o una de sus sales fisiológicamente aceptables, o un solvato correspondiente, para la fabricación de un medicamento para la profilaxis y/o tratamiento de hiperkinesia infantil.
50. Uso de al menos un compuesto sulfonamídico derivado de benzoxazinona de fórmula general (Ia) según cualquiera de las reivindicaciones 21-34, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, su racemato o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros en cualquier relación de mezcla, o una de sus sales fisiológicamente aceptables, o un solvato correspondiente; para la fabricación de un medicamento para la profilaxis y/o tratamiento de ADHC (attention deficit/hyperactivity disorder).
51. Uso de al menos un compuesto sulfonamídico derivado de benzoxazinona de fórmula general (Ia) según cualquiera de las reivindicaciones 21-34, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, su racemato o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros en cualquier relación de mezcla, o una de sus sales fisiológicamente aceptables, o un solvato correspondiente, para la fabricación de un medicamento para la profilaxis y/o tratamiento de trastornos del aparato digestivo, preferiblemente síndrome del intestino irritable.

52. Uso de al menos un compuesto sulfonamídico derivado de benzoxazinona de fórmula general (Ia) según cualquiera de las reivindicaciones 21-34, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, su racemato o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros en cualquier relación de mezcla, o una de sus sales fisiológicamente aceptables, o un solvato correspondiente, para la fabricación de un medicamento para la profilaxis y/o tratamiento de la esquizofrenia.
- 10 53. Uso de al menos un compuesto sulfonamídico derivado de benzoxazinona de fórmula general (Ia) según cualquiera de las reivindicaciones 21-34, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diasterómeros, su racemato o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros en cualquier relación de mezcla, o una de sus sales fisiológicamente aceptables, o un solvato correspondiente, para la fabricación de un medicamento para la mejora de la cognición.
- 15